

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2001年3月1日 (01.03.2001)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 01/14406 A1

(51) 国際特許分類: C07J 1/00, 31/00, 41/00, A61K 31/568

(21) 国際出願番号: PCT/JP00/05636

(22) 国際出願日: 2000年8月23日 (23.08.2000)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願平11/274956 1999年8月23日 (23.08.1999) JP  
特願平11/338334 1999年10月22日 (22.10.1999) JP  
特願2000/237721 2000年6月30日 (30.06.2000) JP  
特願2000/219800 2000年7月19日 (19.07.2000) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 中外製薬株式会社 (CHUGAI SEIYAKU KABUSHIKI KAISHA) [JP/JP]; 〒115-8543 東京都北区浮間5丁目5番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 海宝晋一 (KAIHO, Shin-ichi) [JP/JP]. 大泉巖雄 (OHIZUMI,

Iwao) [JP/JP]. 加藤伸明 (KATO, Nobuaki) [JP/JP]. 米屋孝明 (YONEYA, Takaaki) [JP/JP]. 橘一生 (TACHIBANA, Kazutaka) [JP/JP]; 〒412-8513 静岡県御殿場市駒門1丁目135番地 中外製薬株式会社内 Shizuoka (JP). 田村邦雄 (TAMURA, Kunio) [JP/JP]; 〒115-8543 東京都北区浮間5丁目5番1号 中外製薬株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 社本一夫, 外 (SHAMOTO, Ichio et al.); 〒100-0004 東京都千代田区大手町二丁目2番1号 新大手町ビル206区 ユアサハラ法律特許事務所 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[続葉有]

(54) Title: ANTIANDROGEN AGENTS

(54) 発明の名称: 抗アンドロゲン剤

(57) Abstract: Androstane derivatives having various substituents at the 7- or 11-position, pharmaceutically acceptable salts thereof or prodrugs of the same and substances serving not as an agonist but as an antagonist for androgen receptors, pharmaceutically acceptable salts thereof or products of the same are useful as antiandrogen agents and, therefore, usable as preventives or remedies for diseases such as prostatic cancer and male pattern baldness.

(57) 要約:

7位もしくは11位に種々の置換基を有するアンドロスタン誘導体化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ、並びにアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグは抗アンドロゲン剤として有用であり、前立腺癌男性型脱毛症などの疾患の予防もしくは治療剤として使用することが可能である。

WO 01/14406 A1

WO 01/14406 A1



添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

明 細 書  
抗アンドロゲン剤

技術分野

- 5      本発明は、7位もしくは11位に種々の置換基を有するアンドロスタン誘導体；アンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質；及び上記アンドロスタン誘導体及び上記物質を含む医薬に関する。

10    背景技術

これまでに、前立腺癌、前立腺肥大症、男性型脱毛症、性的早熟、尋常性座瘡、脂漏症及び多毛症と男性ホルモンであるアンドロゲンとが深く関わっていることが知られてきている。例えば、去勢された人や性腺不全症の人には前立腺癌、及び前立腺肥大症がほとんどみられないことが知られている。

- 15      すでに抗アンドロゲン剤、すなわちアンドロゲン受容体のアンタゴニストとして、例えば、酢酸シプロテロン、酢酸クロルマジノン、フルタミド、ピカルタミドなどが用いられている。酢酸シプロテロンは、十代の人の座瘡の進行や禿頭の発生を抑制することが知られている。また、酢酸シプロテロンは、女性においては、男性化と脱毛症の治療に用いられている。フルタミド、ピカルタミドは、前  
20    立腺癌治療薬として使用されている。

これらの抗アンドロゲン剤は、前立腺癌における薬物治療を始めとする多くの例で奏効し、有効な治療剤の一つとなっているが、問題点の1つとして、抗アンドロゲン剤が奏効しても2年から5年後にはほとんどの場合再発症してしまうこと、つまりアンドロゲン抵抗性になってしまうことが知られている。

- 25      ところで、最近、フルタミドの活性本体のヒドロキシフルタミドが10mol/Lの濃度で、アンドロゲンレセプターの転写活性を上昇させることが報告された。またフルタミドで治療を受けている前立腺癌患者のヒドロキシフルタミドの血中濃度は数mol/Lで、この濃度は、上記の報告によると、アゴニスト作用を示す濃度である（J. Biol. Chem., vol. 270, 19998-20003, 1995を参照）。また、去勢

ラットに酢酸シプロテロン及び酢酸クロルマジノンと2週間連続投与すると、前立腺重量が増加することが報告されている(日本内分泌学会誌、vol. 66 597-606, 1990)。また、フルタミド及びピカルタミドについては、肝毒性などの副作用の報告例もある。

- 5 一方、核内受容体に対して、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質、すなわち完全に受容体の働きを阻害できる物質、いわゆる純アンタゴニストは、エストロゲン受容体について知られている(WO 98/25916号公報、ヨーロッパ特許公開0138504号公報、米国特許4,659,516号公報及びCancer Res., 1991, 51, 3867等を参照)。また、核内受
- 10 容体のホルモン結合ドメインの分子構造は、X線結晶構造解析等により、RXR (retinoid-X receptor)、RAR (retinoic acid receptor)などで明らかになってきている(例えば、Nature, vol. 375, 377-382, 1995等を参照)。

WO 97/49709には、非ステロイド型の4環系化合物であるアンドロゲン受容体調節剤が開示されている。

- 15 7位にアミノカルボニルアルキル基又は17位にアミノカルボニルアルキル基を有するステロイド化合物としては、WO 91/00732号公報記載のものが知られている。これらはアンドロゲン合成の阻害物質及び/又はアンドロゲン受容体に対しアンタゴニストとして作用する物質であり、一般式として1(2)位、4(5)位、6(7)位、9(10)位及び/又は11(12)位に任意に
- 20 取捨選択可能な二重結合を有するステロイド化合物が開示されており、具体的な化合物としては4(5)位に二重結合を有する化合物のみが開示されている。最も好ましい化合物として7 $\alpha$ 位に10-(N-ブチル-N-メチルアミノカルボニル)デシル基、17 $\beta$ 位に水酸基を有するステロイド化合物であるEM-101などが挙げられている。しかしながら、これらの化合物は、アンドロゲン受容
- 25 体に対するアンタゴニスト作用が十分ではない、毒性が強い等の問題がある。

11位に芳香環又はアルキルオキシ基を有するステロイド化合物としては、例えばWO 95/17192号公報記載の、RU 486が、多剤耐性の改善剤として知られている。



## 発明の開示

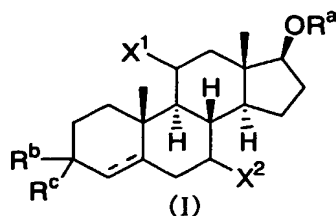
本発明の一つの目的は、7位もしくは11位に種々の置換基を有するアンドロスタン誘導体又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグを提供することである。

- 5 本発明の別の目的は、アンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグを提供することである。

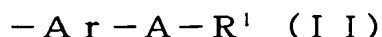
本発明のさらに別の目的は、上記アンドロスタン誘導体を含む医薬及び上記物質を含む医薬を提供することである。

- 10 本発明者は、上記課題を解決することを目的として、従来知られたアンドロゲン受容体のアンタゴニストの、アンドロゲン抵抗性及び前立腺重量の増加などの副作用は、該アンタゴニストが有するアゴニスト作用によりアンドロゲン応答性の細胞（前立腺細胞等）が増殖することが、原因の1つであると推定し、アンドロゲン受容体に対してアゴニストとして作用しないアンタゴニスト、すなわちア
- 15 ンドロゲン受容体に対する純アンタゴニストを見いだせば、長期投与によるアンドロゲン抵抗性の発現や肝毒性などの副作用を示さない抗アンドロゲン剤を見いだすことができると期待し、該アンタゴニストの設計に着手した。第1に、既存のRXR, RAR等の核内受容体からアンドロゲン受容体を、Homology (MSI社)、Look (MAG社)等のソフトウェアを用いるホモロジー法でモデリングし、第2に、ア
- 20 ンドロゲン受容体における純アンタゴニストを、テストステロン及び／又はジヒドロテストステロンをリガンドとして用い、得られた該リガンドとアンドロゲン受容体との複合体モデルを利用して、適当な位置に、受容体との相互作用を形成する、適当な長さで官能基を有する側鎖を導入することにより設計すれば、アンドロゲン受容体に対する純アンタゴニストであると期待できる物質もしくは化合物、及び／又は、肝毒性等の副作用が軽減された抗アンドロゲン剤が設計できる
- 25 ことを見だし、本発明を完成するに至った。

本発明の第1の側面によれば、一般式 (I)



[式中、X¹及びX²は、独立して水素原子、又は一般式 (I I)



- 5      で表される基を示し、Rᵃは、水素原子又は水酸基の保護基を示し、Rᵇ及びRᶜは、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に、保護されていてもよい—(C=O)—を示し、破線は、実線と共に、単結合又は二重結合を形成していることを示す。

- 10      更に、Arは、単結合又は芳香族炭化水素基を示し、Aは、メチレン基又は—O—を示し、R¹は、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、又は置換されていてもよいアルキニル基を示す。

ただし、X¹及びX²は、同時に水素原子であることはない。]

で表される化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグが提供される。

- 15      本発明の第2の側面によれば、アンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグが提供される。

- 20      本発明の第3の側面によれば、一般式 (I) で表される化合物を含む医薬、及び、アンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質を含む医薬が提供される。

#### 発明を実施するための最良の形態

本明細書において、炭素数1～3の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、及びi-プロピル基が挙げられる。

- 25      また、炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、

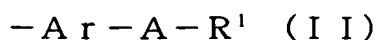
i-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、3-メチルブチル基、2-メチルブチル基、1-メチルブチル基、1-エチルプロピル基、及びn-ヘキシル基等が挙げられる。

5 本明細書において、 $\omega$ 位とは、2価基における、1位とは異なる、もう1つの末端位を意味する。例えば、ヘキサノー1, 6-ジイル基において、 $\omega$ 位は6位である。

本明細書において、単結合とは、該基が存在せず、該基の両隣の基が、直接単結合を形成していることを意味する。例えば、一般式(I I)で表される基において、Arが単結合であるとは、一般式(I)で表される化合物におけるステロ  
10 イド環の7位及び/又は11位とAとが直接単結合を形成していることを示す。

本明細書において、破線は、実線と共に、単結合又は二重結合を形成しているとは、例えば、一般式(I)で表される化合物において、破線が存在するステロ  
15 イド環の4位と5位の間の結合が、単結合又は二重結合であることを意味する。後述する、A法における化合物(2)においても、破線が存在するステロイド環の5位と6位の間の結合が、単結合又は二重結合であることを意味する。

一般式(I)で表される化合物の定義において、 $X^1$ 及び $X^2$ は、独立して水素原子、又は一般式(I I)



(ここで、更に、Arは、単結合又は芳香族炭化水素基を示し、Aは、メチレン基又は-O-を示し、 $R^1$ は、置換基されていてもよいアルキル基、置換基されていてもよいアルケニル基、又は置換基されていてもよいアルキニル基を示す。  
20 )

で表される基を示すが、好ましくは、 $X^1$ が $-Ar-A-R^1$ (式中、Ar、A及び $R^1$ は前記と同義である)であり、かつ、 $X^2$ が水素原子である場合、及び $X^1$ が  
25 水素原子であり、かつ、 $X^2$ が $-Ar-A-R^1$ (式中、Ar、A及び $R^1$ は前記と同義である)である場合が挙げられる。さらに、ステロイド環の11位の $X^1$ の立体配置が、 $\beta$ 配置であるもの、及び7位の $X^2$ の立体配置が、 $\alpha$ 配置であるものが好ましい。ただし、 $X^1$ 及び $X^2$ は、同時に水素原子であることはない。

$R^2$ は、水素原子又は水酸基の保護基を示すが、好ましくは水素原子を示す。水

酸基の保護基としては、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、イソバレリル基、ピバロイル基、カプロイル基、トリフルオロアセチル基、及びベンゾイル基等のアシル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、アリルオキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、及びフェノキシカルボニル基等のアルコキシカルボニル基、トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、トリイソプロピルシリル基、ジメチルイソプロピルシリル基、ジエチルイソプロピルシリル基、ジメチルテキシルシリル基、*t*-ブチルジメチルシリル基、*t*-ブチルジフェニルシリル基、トリベンジルシリル基、トリ-*p*-キシルシリル基、トリフェニルシリル基、ジフェニルメチルシリル基、及び*t*-ブチルメトキシフェニルシリル基等の置換シリル基、メトキシメチル基、メトキシエトキシメチル基、メチルチオメチル基、*t*-ブチルチオメチル基、 $\beta$ -トリクロロエチルオキシメチル基、トリメチルシリルエトキシメチル基、*p*-メトキシベンジルオキシメチル基、及び*p*-クロロベンジルオキシメチル基等の置換メチル基、テトラヒドロフラリル、及びテトラヒドロピラニル基等の2-オキサシクロアルキル基、並びにベンジル基等のアラルキル基が挙げられる。中でもトリメチルシリル基、トリエチルシリル基、トリイソプロピルシリル基、ジメチルイソプロピルシリル基、ジエチルイソプロピルシリル基、ジメチルテキシルシリル基、*t*-ブチルジメチルシリル基、*t*-ブチルジフェニルシリル基、トリベンジルシリル基、トリ-*p*-キシルシリル基、トリフェニルシリル基、ジフェニルメチルシリル基、及び*t*-ブチルメトキシフェニルシリル基等の置換シリル基、並びにメトキシメチル基、メトキシエトキシメチル基、メチルチオメチル基、*t*-ブチルチオメチル基、 $\beta$ -トリクロロエチルオキシメチル基、トリメチルシリルエトキシメチル基、*p*-メトキシベンジルオキシメチル基、及び*p*-クロロベンジルオキシメチル基等の置換メチル基が好ましく、*t*-ブチルジメチルシリル基及びメトキシメチル基が特に好ましい。

R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって、保護されていてもよい-C(=O)-を示すが、好ましくは-C(=O)-を示す。保護されている-C(=O)-としては、ジメトキシメチレン、ビス(2, 2,

ートリクロロエチルオキシ)メチレン、ジベンジルメチレン、ビス(2-ニトロ  
ベンジルオキシ)メチレン、ビス(アセチルオキシ)メチレン、ビス(メチルチ  
オ)メチレン、ビス(エチルチオ)メチレン、ビス(プロピルチオ)メチレン、  
ビス(ブチルチオ)メチレン、ビス(フェニルチオ)メチレン、ビス(ベンジル  
5 チオ)メチレン、ビス(アセチルチオ)メチレン、トリメチルシリルオキシメチ  
ルチオメチレン、トリメチルシリルオキシエチルチオメチレン、トリメチルシリ  
ルオキシフェニルチオメチレン、メチルオキシメチルチオメチレン、メチルオキ  
シフェニルチオメチレン、メチルオキシ-2-(メチルチオ)エチルチオメチレ  
ン、ビス(メチルセレネニル)メチレン、及びビス(フェニルセレネニル)メチ  
10 レン等の非環状であるアセタールもしくはケタール、並びに1, 3-ジオキサン  
、5, 5-ジブプロモ-1, 3-ジオキサン、5-(2-ピリジル)-1, 3-ジ  
オキサン、1, 3-ジオキソラン、4-ブプロモメチル-1, 3-ジオキソラン、  
4-(3-ブテニル)-1, 3-ジオキソラン、4-フェニル-1, 3-ジオキ  
ソラン、4-(2-ニトロフェニル)-1, 3-ジオキソラン、4, 5-ジメト  
15 キシメチル-1, 3-ジオキソラン、1, 5-ジヒドロ-3H-2, 4-ベンゾ  
ジオキセピン、1, 3-ジチアン、1, 3-ジチオラン、1, 5-ジヒドロ-3  
H-2, 4-ベンゾジチエピン、1, 3-オキサチオラン等の環状であるアセタ  
ールもしくはケタールを挙げることができるが、好ましくは1, 3-ジオキサン  
、1, 3-ジオキソラン、及び1, 3-ジチアン等が挙げられ、特に好ましくは  
20 1, 3-ジオキソラン等が挙げられる。

破線は、実線と共に、単結合又は二重結合を形成していること、すなわち、ス  
テロイド環の4位と5位との間の結合としては、単結合及び二重結合が挙げられ  
ることを示すが、好ましくは単結合を形成していることを示す。破線が実線と共  
に、単結合を形成する場合は、ステロイド環の5位の水素原子は $\alpha$ 配置であるの  
25 が好ましい。

一般式(II)で表される基において、Arは、単結合又は芳香族炭化水素基  
を示す。

Arにおける芳香族炭化水素基の、芳香族炭化水素環としては、ベンゼン環、  
ナフタレン環、アントラセン環、ナフタセン環、ペンタセン環、ヘキサセン環、

フェナントレン環、トリフェニレン環、ピレン環、クリセン環、ピセン環、ペリレン環、ペンタフェン環、コロネン環、ヘプタフェン環、ピラントレン環、及びオバレン環等が挙げられるが、好ましくはベンゼン環が挙げられる。A<sub>r</sub>における芳香族炭化水素基は、これらの芳香族炭化水素環中の、異なる2つの位置に、

5 1個ずつ結合手を有する基を意味するが、好ましくは、p-フェニレン基が挙げられる。

Aは、メチレン基又は-O-を示すが、メチレン基であるのが好ましい。

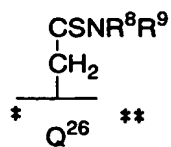
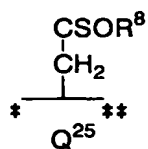
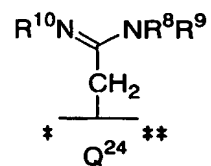
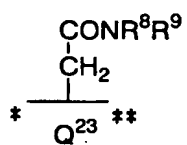
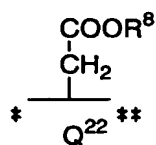
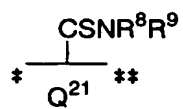
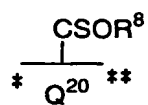
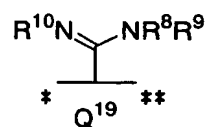
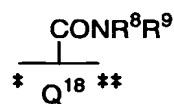
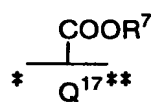
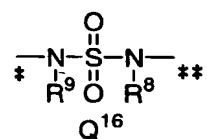
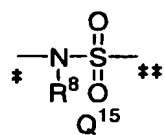
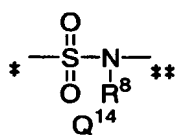
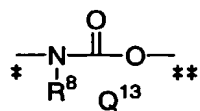
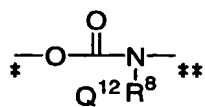
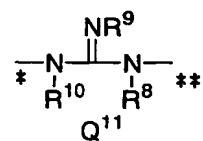
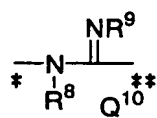
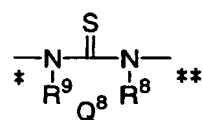
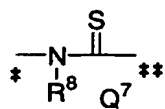
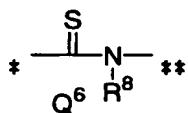
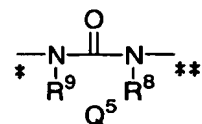
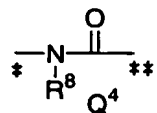
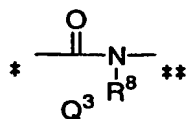
また、A<sub>r</sub>が芳香族炭化水素基である場合は、Aが-O-であるのが好ましい。

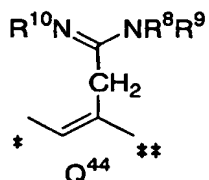
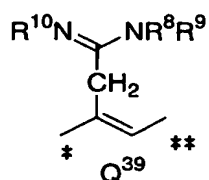
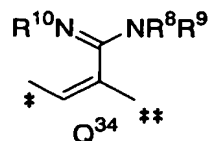
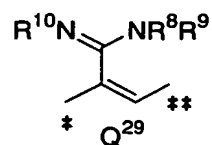
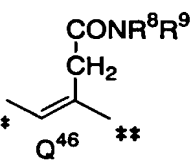
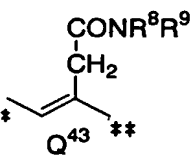
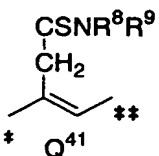
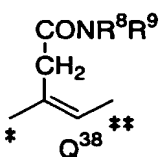
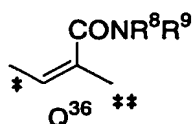
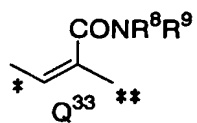
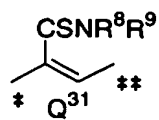
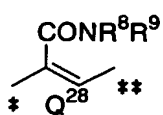
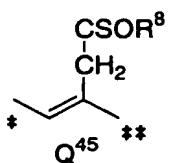
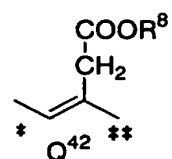
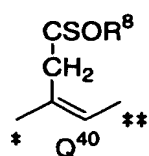
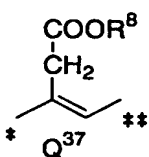
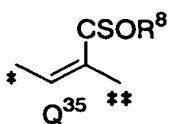
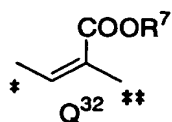
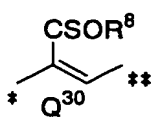
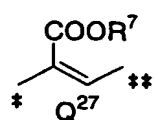
- 10 R<sup>1</sup>は、置換基されていてもよいアルキル基、置換基されていてもよいアルケニル基、又は置換基されていてもよいアルキニル基を示すが、好ましくは、R<sup>1a</sup>

[ここで、R<sup>1a</sup>は、一般式 (I I I)



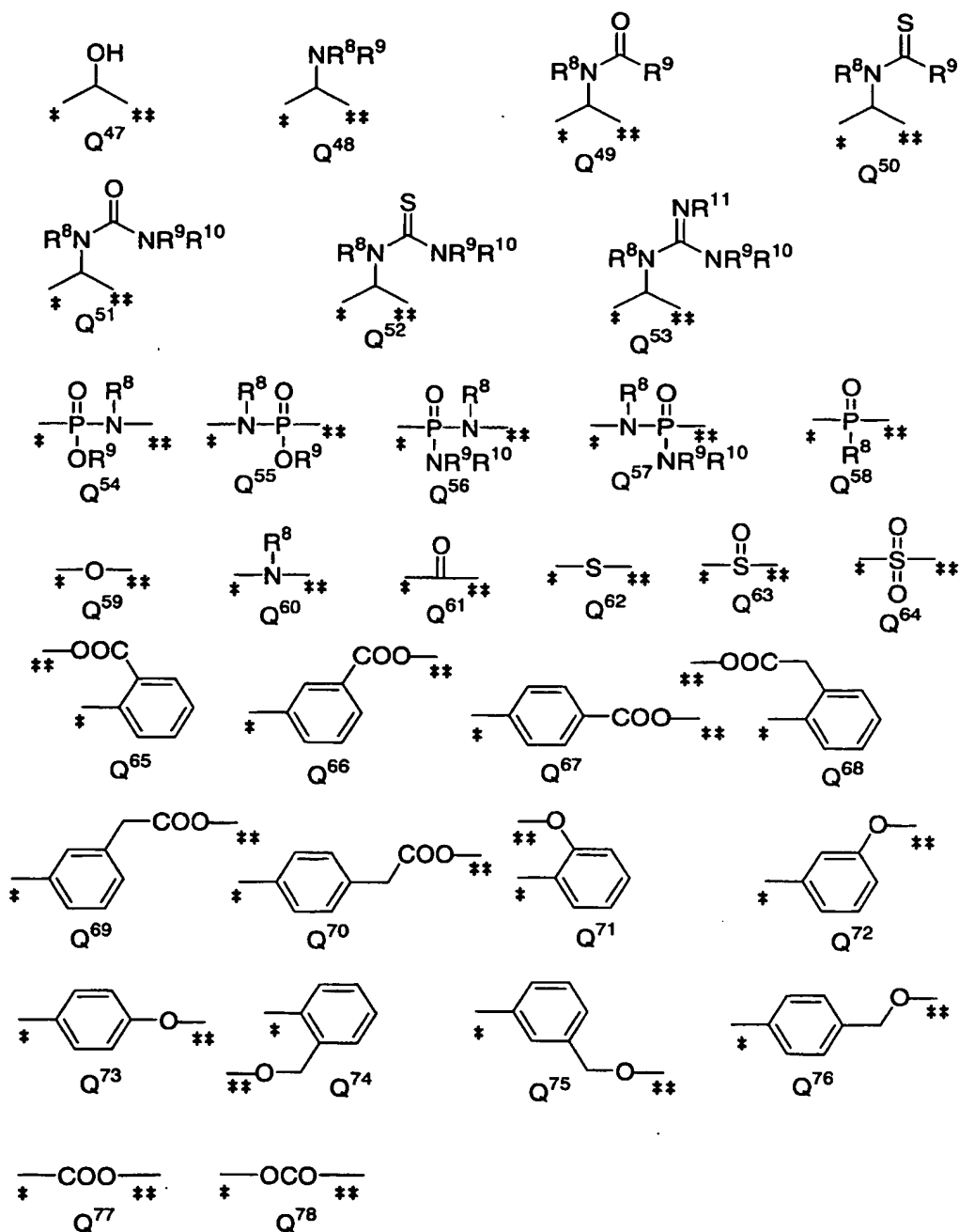
- 15 {式中、Gは、置換されていてもよい炭素数1~30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基、置換されていてもよい炭素数2~30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基、又は置換されていてもよい炭素数2~30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基を示し、Eは、単結合又は-O-を示し、Jは、単結合、置換されていてもよい芳香族炭化水素基、又は置換されていてもよい複素環基
- 20 を示し、Yは、単結合又は-O-を示し、Lは、単結合、炭素数1~10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基、炭素数2~10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基、又は炭素数2~10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基を示し、Qは、単結合、又は下記式：





、及び





(ここで、R<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>は、独立して、水素原子、又は炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示し、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、及びR<sup>11</sup>は、それぞれ独立して、水素原子、又は炭素数1～3の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示す。

から選択される1つの基を示し、Zは、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数2～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数2～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニル基、 $-O-R^d$ （ここで、 $R^d$ は、水素原子、又は水酸基の保護基を示す）、又は $-COOH$ を示す。）を示す。ただし、Qが $Q^3$ である場合、 $Q^3$ の窒素原子と $R^8$ とZとが一緒になって複素環基を形成してもよい。} ] である。

Gにおける、置換されていてもよい炭素数1～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基、置換されていてもよい炭素数2～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基、及び置換されていてもよい炭素数2～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基の置換基としては、 $-(CH_2)_m-COOR^{7a}$ 、 $-(CH_2)_p-CONR^{8a}R^{9a}$ 、 $-NR^{8b}R^{9b}$ 、水酸基、及びオキソ基等が挙げられる。ここで、m及びpは、独立して、0又は1を示し、 $R^{7a}$ は、水素原子、又は炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を示し、 $R^{8a}$ 、 $R^{9a}$ 、 $R^{8b}$ 、及び $R^{9b}$ は、それぞれ独立して、水素原子、又は炭素数1～3の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を示す。また、この置換基は、存在しないか又は水酸基であるのが好ましく、存在しないのが特に好ましい。なお、Gが置換されている場合、この置換基の数は、1個～4個であり、好ましくは1個である。

Gにおける、置換されていてもよい炭素数1～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基の、炭素数1～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基としては、メチレン基、エタン-1，2-ジイル基、プロパン-1，3-ジイル基、ブタン-1，4-ジイル基、ペンタン-1，5-ジイル基、ヘキサン-1，6-ジイル基、ヘプタン-1，7-ジイル基、オクタン-1，8-ジイル基、ノナン-1，9-ジイル基、デカン-1，10-ジイル基、ウンデカン-1，11-ジイル基、ドデカン-1，12-ジイル基、トリデカン-1，13-ジイル基、テトラデカン-1，14-ジイル基、ペンタデカン-1，15-ジイル基、ヘキサデカン-1，16-ジイル基、ヘプタデカン-1，17-ジイル基、オクタデカン-1，18-ジイル基、ノナデカン-1，19-ジイル基、イコサン-1，20-ジイル基、ヘニコサン-1，21-ジイル基、ドコサン-1，22-ジイル基

、トリコサン-1, 23-ジイル基、テトラコサン-1, 24-ジイル基、ペン  
タコサン-1, 25-ジイル基、ヘキサコサン-1, 26-ジイル基、ヘプタコ  
サン-1, 27-ジイル基、オクタコサン-1, 28-ジイル基、ノナコサン-  
1, 29-ジイル基、及びトリアコンタン-1, 30-ジイル基である直鎖状の  
5 アルキレン基、

並びに、2-メチルプロパン-1, 3-ジイル基、2-メチルブタン-1, 4-  
ジイル基、3-メチルブタン-1, 4-ジイル基、2, 3-ジメチルブタン-1  
、4-ジイル基、2-メチルペンタン-1, 5-ジイル基、3-メチルペンタン  
-1, 5-ジイル基、4-メチルペンタン-1, 5-ジイル基、2, 3-ジメチ  
10 ルペンタン-1, 5-ジイル基、2, 4-ジメチルペンタン-1, 5-ジイル基  
、3, 3-ジメチルペンタン-1, 5-ジイル基、3, 4-ジメチルペンタン-  
1, 5-ジイル基、2, 3, 4-トリメチルペンタン-1, 5-ジイル基、3-  
エチルペンタン-1, 5-ジイル基、3-エチル-2-メチルペンタン-1, 5-  
ジイル基、3-エチル-4-メチルペンタン-1, 5-ジイル基、2, 4-ジ  
15 メチル-3-エチルペンタン-1, 5-ジイル基、2-メチルヘキサン-1, 6-  
ジイル基、3-メチルヘキサン-1, 6-ジイル基、4-メチルヘキサン-1  
、6-ジイル基、5-メチルヘキサン-1, 6-ジイル基、2, 3-ジメチルヘ  
キサン-1, 6-ジイル基、2, 4-ジメチルヘキサン-1, 6-ジイル基、2  
、5-ジメチルヘキサン-1, 6-ジイル基、3, 3-ジメチルヘキサン-1,  
20 6-ジイル基、3, 4-ジメチルヘキサン-1, 6-ジイル基、3, 5-ジメチ  
ルヘキサン-1, 6-ジイル基、4, 4-ジメチルヘキサン-1, 6-ジイル基  
、4, 5-ジメチルヘキサン-1, 6-ジイル基、2, 3, 3-トリメチルヘキ  
サン-1, 6-ジイル基、2, 3, 4-トリメチルヘキサン-1, 6-ジイル基  
、2, 3, 5-トリメチルヘキサン-1, 6-ジイル基、2, 4, 4-トリメチ  
25 ルヘキサン-1, 6-ジイル基、2, 4, 5-トリメチルヘキサン-1, 6-ジ  
イル基、3, 3, 4-トリメチルヘキサン-1, 6-ジイル基、3, 3, 5-ト  
リメチルヘキサン-1, 6-ジイル基、3, 4, 5-トリメチルヘキサン-1,  
6-ジイル基、4, 4, 5-トリメチルヘキサン-1, 6-ジイル基、2, 3,  
4, 5-テトラメチルヘキサン-1, 6-ジイル基、3-エチルヘキサン-1,

- 6-ジイル基、4-エチルヘキサン-1, 6-ジイル基、3-エチル-2-メチルヘキサン-1, 6-ジイル基、3-エチル-4-メチルヘキサン-1, 6-ジイル基、3-エチル-5-メチルヘキサン-1, 6-ジイル基、4-エチル-2-メチルヘキサン-1, 6-ジイル基、4-エチル-3-メチルヘキサン-1,
- 5 6-ジイル基、4-エチル-5-メチルヘキサン-1, 6-ジイル基、2, 4-ジメチル-3-エチルヘキサン-1, 6-ジイル基、2, 5-ジメチル-3-エチルヘキサン-1, 6-ジイル基、4, 5-ジメチル-3-エチルヘキサン-1, 6-ジイル基、2, 3-ジメチル-4-エチルヘキサン-1, 6-ジイル基、2, 5-ジメチル-4-エチルヘキサン-1, 6-ジイル基、3, 5-ジメチル-4-エチルヘキサン-1, 6-ジイル基、3, 4-ジエチルヘキサン-1, 6-ジイル基、
- 10 2-メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、3-メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、4-メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、5-メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、6-メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 3-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 4-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 5-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 6-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、3, 3-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、3, 4-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、3, 5-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、3, 6-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、4, 4-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、4, 5-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、4, 6-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、5, 5-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、5, 6-ジメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 3, 3-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 3, 4-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 3, 5-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 3, 6-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 4, 4-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 4, 5-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 4, 6-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 5, 5-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、2, 5, 6-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、3, 3, 4-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、3, 3, 5-トリメチルヘプタン-1

， 7-ジイル基、 3, 3, 6-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 3, 4  
， 4-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 3, 4, 5-トリメチルヘプタ  
ン-1, 7-ジイル基、 3, 4, 6-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、  
3, 5, 5-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 3, 5, 6-トリメチル  
5 ヘプタン-1, 7-ジイル基、 4, 4, 5-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイ  
ル基、 4, 4, 6-トリメチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 4, 5, 5-トリ  
メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 4, 5, 6-トリメチルヘプタン-1, 7  
-ジイル基、 3-エチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 4-エチルヘプタン-1  
， 7-ジイル基、 5-エチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 3-エチル-2-メ  
10 チルヘプタン-1, 7-ジイル基、 3-エチル-4-メチルヘプタン-1, 7-  
ジイル基、 3-エチル-5-メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 3-エチル-  
6-メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 4-エチル-2-メチルヘプタン-1  
， 7-ジイル基、 4-エチル-3-メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 4-エ  
チル-4-メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 4-エチル-5-メチルヘプタ  
15 ン-1, 7-ジイル基、 4-エチル-6-メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、  
5-エチル-2-メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 5-エチル-3-メチル  
ヘプタン-1, 7-ジイル基、 5-エチル-4-メチルヘプタン-1, 7-ジイ  
ル基、 5-エチル-5-メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 5-エチル-6-  
メチルヘプタン-1, 7-ジイル基、 4-n-プロピルヘプタン-1, 7-ジイ  
20 ル基、 4-i-プロピルヘプタン-1, 7-ジイル基、  
2-メチルオクタン-1, 8-ジイル基、 3-メチルオクタン-1, 8-ジイル  
基、 3-メチルオクタン-1, 8-ジイル基、 4-メチルオクタン-1, 8-ジ  
イル基、 5-メチルオクタン-1, 8-ジイル基、 6-メチルオクタン-1, 8  
-ジイル基、 7-メチルオクタン-1, 8-ジイル基、 2, 3-ジメチルオクタ  
25 ン-1, 8-ジイル基、 2, 4-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、 2, 5  
-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、 2, 6-ジメチルオクタン-1, 8-  
ジイル基、 2, 7-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、 3, 3-ジメチルオ  
クタン-1, 8-ジイル基、 3, 4-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、 3  
， 5-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、 3, 6-ジメチルオクタン-1,

- 8-ジイル基、3, 7-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、4, 4-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、4, 5-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、4, 6-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、4, 7-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、5, 5-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、5, 6-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、5, 7-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、6, 6-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、6, 7-ジメチルオクタン-1, 8-ジイル基、3-エチルオクタン-1, 8-ジイル基、4-エチルオクタン-1, 8-ジイル基、5-エチルオクタン-1, 8-ジイル基、6-エチルオクタン-1, 8-ジイル基、2-メチルノナン-1, 9-ジイル基、3-メチルノナン-1, 9-ジイル基、4-メチルノナン-1, 9-ジイル基、5-メチルノナン-1, 9-ジイル基、6-メチルノナン-1, 9-ジイル基、7-メチルノナン-1, 9-ジイル基、8-メチルノナン-1, 9-ジイル基、2-メチルデカン-1, 10-ジイル基、3-メチルデカン-1, 10-ジイル基、4-メチルデカン-1, 10-ジイル基、5-メチルデカン-1, 10-ジイル基、6-メチルデカン-1, 10-ジイル基、7-メチルデカン-1, 10-ジイル基、8-メチルデカン-1, 10-ジイル基、4-エチルデカン-1, 10-ジイル基、5-エチルデカン-1, 10-ジイル基、6-エチルデカン-1, 10-ジイル基、7-エチルデカン-1, 10-ジイル基、5-n-プロピルデカン-1, 10-ジイル基、6-n-プロピルデカン-1, 10-ジイル基、3-エチル-2-メチルデカン-1, 10-ジイル基、4-エチル-2-メチルデカン-1, 10-ジイル基、5-エチル-2-メチルデカン-1, 10-ジイル基、6-エチル-2-メチルデカン-1, 10-ジイル基、7-エチル-2-メチルデカン-1, 10-ジイル基、3-エチル-3-メチルデカン-1, 10-ジイル基、4-エチル-3-メチルデカン-1, 10-ジイル基、5-エチル-3-メチルデカン-1, 10-ジイル基、6-エチル-3-メチルデカン-1, 10-ジイル基、7-エチル-3-メチルデカン-1, 10-ジイル基、3-エチル-4-メチルデカン-1, 10-ジイル基、4-エチル-4-メチルデカン-1, 10-ジイル基、5-エチル-4-メチルデカン-1, 10-ジイル基、6-エチル-4-メチルデカン-1, 10-ジイル基、7-エチル-4-メ

- チルデカン-1, 10-ジイル基、3-エチル-5-メチルデカン-1, 10-ジイル基、4-エチル-5-メチルデカン-1, 10-ジイル基、5-エチル-5-メチルデカン-1, 10-ジイル基、6-エチル-5-メチルデカン-1, 10-ジイル基、7-エチル-5-メチルデカン-1, 10-ジイル基、
- 5 2-メチルウンデカン-1, 11-ジイル基、3-メチルウンデカン-1, 11-ジイル基、4-メチルウンデカン-1, 11-ジイル基、5-メチルウンデカン-1, 11-ジイル基、6-メチルウンデカン-1, 11-ジイル基、7-メチルウンデカン-1, 11-ジイル基、8-メチルウンデカン-1, 11-ジイル基、9-メチルウンデカン-1, 11-ジイル基、10-メチルウンデカン-
- 10 1, 11-ジイル基、3-エチルウンデカン-1, 11-ジイル基、4-エチルウンデカン-1, 11-ジイル基、5-エチルウンデカン-1, 11-ジイル基、6-エチルウンデカン-1, 11-ジイル基、7-エチルウンデカン-1, 11-ジイル基、8-エチルウンデカン-1, 11-ジイル基、9-エチルウンデカン-1, 11-ジイル基、
- 15 2-メチルドデカン-1, 12-ジイル基、3-メチルドデカン-1, 12-ジイル基、4-メチルドデカン-1, 12-ジイル基、5-メチルドデカン-1, 12-ジイル基、6-メチルドデカン-1, 12-ジイル基、7-メチルドデカン-1, 12-ジイル基、8-メチルドデカン-1, 12-ジイル基、9-メチルドデカン-1, 12-ジイル基、10-メチルドデカン-1, 12-ジイル基、
- 20 11-メチルドデカン-1, 12-ジイル基、
- 3-エチルドデカン-1, 12-ジイル基、4-エチルドデカン-1, 12-ジイル基、5-エチルドデカン-1, 12-ジイル基、6-エチルドデカン-1, 12-ジイル基、7-エチルドデカン-1, 12-ジイル基、8-エチルドデカン-1, 12-ジイル基、9-エチルドデカン-1, 12-ジイル基、10-エチルドデカン-1, 12-ジイル基、
- 25 2-メチルトリデカン-1, 13-ジイル基、3-メチルトリデカン-1, 13-ジイル基、4-メチルトリデカン-1, 13-ジイル基、5-メチルトリデカン-1, 13-ジイル基、6-メチルトリデカン-1, 13-ジイル基、7-メチルトリデカン-1, 13-ジイル基、8-メチルトリデカン-1, 13-ジイ

- ル基、9-メチルトリデカン-1, 13-ジイル基、10-メチルトリデカン-1, 13-ジイル基、11-メチルトリデカン-1, 13-ジイル基、12-メチルトリデカン-1, 13-ジイル基、
- 5 3-エチルトリデカン-1, 13-ジイル基、4-エチルトリデカン-1, 13-ジイル基、5-エチルトリデカン-1, 13-ジイル基、6-エチルトリデカン-1, 13-ジイル基、7-エチルトリデカン-1, 13-ジイル基、8-エチルトリデカン-1, 13-ジイル基、9-エチルトリデカン-1, 13-ジイル基、10-エチルトリデカン-1, 13-ジイル基、11-エチルトリデカン-1, 13-ジイル基、
- 10 2-メチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、3-メチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、4-メチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、5-メチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、6-メチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、7-メチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、8-メチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、9-メチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、10-メチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、11-メチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、12-メチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、13-メチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、
- 15 3-エチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、4-エチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、5-エチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、6-エチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、7-エチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、8-エチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、9-エチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、10-エチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、11-エチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、12-エチルテトラデカン-1, 14-ジイル基、
- 20 2-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、3-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、4-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、5-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、6-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、7-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、8-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、9-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、10-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、
- 25 2-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、3-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、4-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、5-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、6-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、7-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、8-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、9-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、10-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、



チルペンタデカン-1, 15-ジイル基、11-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、12-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、13-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、14-メチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、

- 5 3-エチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、4-エチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、5-エチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、6-エチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、7-エチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、8-エチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、9-エチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、10-エチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、11-エチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、12-エチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、13-エチルペンタデカン-1, 15-ジイル基、
- 10 2-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、3-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、4-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、5-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、6-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、7-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、8-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、9-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、10-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、11-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、12-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、13-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、14-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、15-メチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、
- 15 3-エチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、4-エチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、5-エチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、6-エチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、7-エチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、8-エチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、9-エチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、10-エチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、11-エチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、12-エチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、13-エチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、14-エチルヘキサデカン-1, 16-ジイル基、
- 20 2-メチルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、3-メチルヘプタデカン-1,

- 17-ジイル基、4-メチルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、5-メチルヘ  
プタデカン-1, 17-ジイル基、6-メチルヘプタデカン-1, 17-ジイル  
基、7-メチルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、8-メチルヘプタデカン-  
1, 17-ジイル基、9-メチルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、10-メ  
5 チルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、11-メチルヘプタデカン-1, 17  
-ジイル基、12-メチルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、13-メチルヘ  
プタデカン-1, 17-ジイル基、14-メチルヘプタデカン-1, 17-ジイ  
ル基、15-メチルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、16-メチルヘプタデ  
カン-1, 17-ジイル基、
- 10 3-エチルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、4-エチルヘプタデカン-1,  
17-ジイル基、5-エチルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、6-エチルヘ  
プタデカン-1, 17-ジイル基、7-エチルヘプタデカン-1, 17-ジイル  
基、8-エチルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、9-エチルヘプタデカン-  
1, 17-ジイル基、10-エチルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、11-  
15 エチルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、12-エチルヘプタデカン-1, 1  
7-ジイル基、13-エチルヘプタデカン-1, 17-ジイル基、14-エチル  
ヘプタデカン-1, 17-ジイル基、15-エチルヘプタデカン-1, 17-ジ  
イル基、
- 2-メチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、3-メチルオクタデカン-1,  
20 18-ジイル基、4-メチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、5-メチルオ  
クタデカン-1, 18-ジイル基、6-メチルオクタデカン-1, 18-ジイル  
基、7-メチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、8-メチルオクタデカン-  
1, 18-ジイル基、9-メチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、10-メ  
チルオクタデカン-1, 18-ジイル基、11-メチルオクタデカン-1, 18  
-ジイル基、12-メチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、13-メチルオ  
25 クタデカン-1, 18-ジイル基、14-メチルオクタデカン-1, 18-ジイ  
ル基、15-メチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、16-メチルオクタデ  
カン-1, 18-ジイル基、17-メチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、  
3-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、4-エチルオクタデカン-1,

- 18-ジイル基、5-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、6-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、7-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、8-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、9-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、10-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、11-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、12-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、13-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、14-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、15-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、16-エチルオクタデカン-1, 18-ジイル基、
- 2-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、3-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、4-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、5-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、6-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、7-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、8-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、9-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、10-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、11-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、12-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、13-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、14-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、15-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、16-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、17-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、18-メチルノナデカン-1, 19-ジイル基、
- 3-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、4-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、5-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、6-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、7-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、8-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、9-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、10-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、11-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、12-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、13-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、14-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、15-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、16-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、17-エチルノナデカン-1, 19-ジイル基、
- 2-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、3-メチルイコサン-1, 20-ジ

- イル基、4-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、5-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、6-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、7-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、8-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、9-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、10-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、11-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、12-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、13-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、14-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、15-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、16-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、17-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、18-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、19-メチルイコサン-1, 20-ジイル基、
- 3-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、4-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、5-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、6-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、7-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、8-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、9-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、10-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、11-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、12-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、13-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、14-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、15-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、16-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、17-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、18-エチルイコサン-1, 20-ジイル基、
- 2-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、3-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、4-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、5-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、6-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、7-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、8-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、9-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、10-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、11-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、12-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、13-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、14-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、15-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、16-メチルヘニコサン-1, 21-ジイル基、17

ーメチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、18-メチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、19-メチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、20-メチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、

3-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、4-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、5-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、6-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、7-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、8-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、9-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、10-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、11-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、12-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、13-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、14-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、15-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、16-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、17-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、18-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、19-エチルヘニコサンー1, 21-ジイル基、

2-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、3-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、4-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、5-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、6-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、7-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、8-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、9-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、10-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、11-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、12-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、13-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、14-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、15-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、16-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、17-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、18-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、19-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、20-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、21-メチルドコサンー1, 22-ジイル基、

3-エチルドコサンー1, 22-ジイル基、4-エチルドコサンー1, 22-ジイル基、5-エチルドコサンー1, 22-ジイル基、6-エチルドコサンー1, 22-ジイル基、7-エチルドコサンー1, 22-ジイル基、8-エチルドコサ

- ン-1, 22-ジイル基、9-エチルドコサン-1, 22-ジイル基、10-エチルドコサン-1, 22-ジイル基、11-エチルドコサン-1, 22-ジイル基、12-エチルドコサン-1, 22-ジイル基、13-エチルドコサン-1, 22-ジイル基、14-エチルドコサン-1, 22-ジイル基、15-エチルドコサン-1, 22-ジイル基、16-エチルドコサン-1, 22-ジイル基、17-エチルドコサン-1, 22-ジイル基、18-エチルドコサン-1, 22-ジイル基、19-エチルドコサン-1, 22-ジイル基、20-エチルドコサン-1, 22-ジイル基、
- 2-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、3-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、4-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、5-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、6-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、7-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、8-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、9-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、10-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、11-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、12-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、13-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、14-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、15-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、16-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、17-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、18-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、19-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、20-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、21-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、22-メチルトリコサン-1, 23-ジイル基、
- 3-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、4-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、5-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、6-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、7-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、8-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、9-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、10-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、11-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、12-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、13-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、14-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、15-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、16-エチルトリコ

- サン-1, 23-ジイル基、17-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、18-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、19-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、20-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、21-エチルトリコサン-1, 23-ジイル基、
- 5 2-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、3-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、4-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、5-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、6-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、7-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、8-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、9-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、10-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、11-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、12-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、13-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、14-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、15-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、16-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、17-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、
- 15 18-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、19-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、20-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、21-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、22-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、23-メチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、
- 3-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、4-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、5-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、6-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、7-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、8-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、9-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、10-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、11-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、12-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、13-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、14-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、15-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、16-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、17-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、18-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、19-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、20-エチルテトラコサン
- 25

ー1, 24-ジイル基、21-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、22-エチルテトラコサン-1, 24-ジイル基、

2-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、3-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、4-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、5-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、6-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、7-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、8-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、9-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、10-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、11-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、12-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、13-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、14-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、15-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、16-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、17-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、18-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、19-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、20-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、21-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、22-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、23-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、24-メチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、

3-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、4-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、5-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、6-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、7-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、8-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、9-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、10-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、11-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、12-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、13-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、14-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、15-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、16-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、17-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、18-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、19-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、20-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、21-エチルペンタコサン-1, 25-ジイル基、22



ーエチルペンタコサンー1, 25-ジイル基、23-エチルペンタコサンー1,  
25-ジイル基、

2-メチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、3-メチルヘキサコサンー1,  
26-ジイル基、4-メチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、5-メチルヘ  
5 キサコサンー1, 26-ジイル基、6-メチルヘキサコサンー1, 26-ジイル  
基、7-メチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、8-メチルヘキサコサンー  
1, 26-ジイル基、9-メチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、10-メ  
チルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、11-メチルヘキサコサンー1, 26  
-ジイル基、12-メチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、13-メチルヘ  
10 キサコサンー1, 26-ジイル基、14-メチルヘキサコサンー1, 26-ジイ  
ル基、15-メチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、16-メチルヘキサコ  
サンー1, 26-ジイル基、17-メチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、  
18-メチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、19-メチルヘキサコサンー  
1, 26-ジイル基、20-メチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、21-  
15 メチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、22-メチルヘキサコサンー1, 2  
6-ジイル基、23-メチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、24-メチル  
ヘキサコサンー1, 26-ジイル基、25-メチルヘキサコサンー1, 26-ジ  
イル基、

3-エチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、4-エチルヘキサコサンー1,  
20 26-ジイル基、5-エチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、6-エチルヘ  
キサコサンー1, 26-ジイル基、7-エチルヘキサコサンー1, 26-ジイル  
基、8-エチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、9-エチルヘキサコサンー  
1, 26-ジイル基、10-エチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、11-  
エチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、12-エチルヘキサコサンー1, 2  
25 6-ジイル基、13-エチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、14-エチル  
ヘキサコサンー1, 26-ジイル基、15-エチルヘキサコサンー1, 26-ジ  
イル基、16-エチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、17-エチルヘキサ  
コサンー1, 26-ジイル基、18-エチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基  
、19-エチルヘキサコサンー1, 26-ジイル基、20-エチルヘキサコサン

- ー1, 26-ジイル基、21-エチルヘキサコサン-1, 26-ジイル基、22-エチルヘキサコサン-1, 26-ジイル基、23-エチルヘキサコサン-1, 26-ジイル基、24-エチルヘキサコサン-1, 26-ジイル基、
- 2-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、3-メチルヘプタコサン-1,
- 5 27-ジイル基、4-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、5-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、6-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、7-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、8-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、9-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、10-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、11-メチルヘプタコサン-1, 27-
- 10 -ジイル基、12-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、13-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、14-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、15-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、16-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、17-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、18-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、19-メチルヘプタコサン-
- 15 1, 27-ジイル基、20-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、21-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、22-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、23-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、24-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、25-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、26-メチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、
- 20 3-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、4-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、5-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、6-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、7-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、8-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、9-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、10-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、11-
- 25 エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、12-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、13-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、14-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、15-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、16-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、17-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、18-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基

- 、 19-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、 20-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、 21-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、 22-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、 23-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、 24-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、 25-エチルヘプタコサン-1, 27-ジイル基、
- 5 2-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 3-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 4-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 5-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 6-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 7-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 8-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 9-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 10-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 11-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 12-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 13-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 14-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 15-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 16-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 17-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 18-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 19-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 20-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 21-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 22-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 23-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 24-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 25-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 26-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 27-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、
- 10 3-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 4-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 5-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 6-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 7-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 8-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 9-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 10-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 11-メチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 12-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 13-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、 14-エチル
- 15 25

- オクタコサン-1, 28-ジイル基、15-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、16-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、17-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、18-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、19-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、20-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、21-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、22-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、23-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、24-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、25-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、26-エチルオクタコサン-1, 28-ジイル基、
- 10 2-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、3-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、4-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、5-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、6-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、7-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、8-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、9-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、10-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、11-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、12-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、13-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、14-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、15-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、16-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、17-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、18-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、19-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、20-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、21-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、22-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、23-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、24-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、25-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、26-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、27-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基、及び28-メチルノナコサン-1, 29-ジイル基等の分岐鎖状のアルキレン基が挙げられる。
- 25

Gにおける、置換されていてもよい炭素数2~30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基の、炭素数2~30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基としては、エチレン-1, 2-ジイル基、1-プロペン-1, 3-ジイル基、2-

- プロペン-1, 3-ジイル基、1-ブテン-1, 4-ジイル基、2-ブテン-1, 4-ジイル基、3-ブテン-1, 4-ジイル基、1, 3-ブタジエン-1, 4-ジイル基、2-ペンテン-1, 5-ジイル基、3-ペンテン-1, 5-ジイル基、2, 4-ペンタジエン-1, 5-ジイル基、2-ヘキセン-1, 6-ジイル基、3-ヘキセン-1, 6-ジイル基、4-ヘキセン-1, 6-ジイル基、2, 4-ヘキサジエン-1, 6-ジイル基、2-ヘプテン-1, 7-ジイル基、3-ヘプテン-1, 7-ジイル基、4-ヘプテン-1, 7-ジイル基、5-ヘプテン-1, 7-ジイル基、2, 4-ヘプタジエン-1, 7-ジイル基、2, 5-ヘプタジエン-1, 7-ジイル基、3, 5-ヘプタジエン-1, 7-ジイル基、2-  
5 オクテン-1, 8-ジイル基、3-オクテン-1, 8-ジイル基、4-オクテン-1, 8-ジイル基、5-オクテン-1, 8-ジイル基、6-オクテン-1, 8-ジイル基、2, 4-オクタジエン-1, 8-ジイル基、2, 5-オクタジエン-1, 8-ジイル基、2, 6-オクタジエン-1, 8-ジイル基、2, 4, 6-  
10 オクタトリエン-1, 8-ジイル基、2-ノネン-1, 9-ジイル基、3-ノネン-1, 9-ジイル基、4-ノネン-1, 9-ジイル基、5-ノネン-1, 9-ジイル基、6-ノネン-1, 9-ジイル基、7-ノネン-1, 9-ジイル基、2-  
15 デセン-1, 10-ジイル基、3-デセン-1, 10-ジイル基、4-デセン-1, 10-ジイル基、5-デセン-1, 10-ジイル基、6-デセン-1, 10-ジイル基、7-デセン-1, 10-ジイル基、8-デセン-1, 10-ジイル基、  
20 ル基、  
2-ウンデセン-1, 11-ジイル基、3-ウンデセン-1, 11-ジイル基、  
4-ウンデセン-1, 11-ジイル基、5-ウンデセン-1, 11-ジイル基、  
6-ウンデセン-1, 11-ジイル基、7-ウンデセン-1, 11-ジイル基、  
8-ウンデセン-1, 11-ジイル基、9-ウンデセン-1, 11-ジイル基、  
25 2-ドデセン-1, 12-ジイル基、3-ドデセン-1, 12-ジイル基、4-  
ドデセン-1, 12-ジイル基、5-ドデセン-1, 12-ジイル基、6-ドデセン-1, 12-ジイル基、7-ドデセン-1, 12-ジイル基、8-ドデセン-1, 12-ジイル基、9-ドデセン-1, 12-ジイル基、10-ドデセン-1, 12-ジイル基、

- 2-トリデセン-1, 13-ジイル基、3-トリデセン-1, 13-ジイル基、  
4-トリデセン-1, 13-ジイル基、5-トリデセン-1, 13-ジイル基、  
6-トリデセン-1, 13-ジイル基、7-トリデセン-1, 13-ジイル基、  
8-トリデセン-1, 13-ジイル基、9-トリデセン-1, 13-ジイル基、  
5 10-トリデセン-1, 13-ジイル基、11-トリデセン-1, 13-ジイル  
基、  
2-テトラデセン-1, 14-ジイル基、3-テトラデセン-1, 14-ジイル  
基、4-テトラデセン-1, 14-ジイル基、5-テトラデセン-1, 14-ジ  
イル基、6-テトラデセン-1, 14-ジイル基、7-テトラデセン-1, 14  
10 -ジイル基、8-テトラデセン-1, 14-ジイル基、9-テトラデセン-1,  
14-ジイル基、10-テトラデセン-1, 14-ジイル基、11-テトラデセ  
ン-1, 14-ジイル基、12-テトラデセン-1, 14-ジイル基、  
2-ペンタデセン-1, 15-ジイル基、3-ペンタデセン-1, 15-ジイル  
基、4-ペンタデセン-1, 15-ジイル基、5-ペンタデセン-1, 15-ジ  
15 イル基、6-ペンタデセン-1, 15-ジイル基、7-ペンタデセン-1, 15  
-ジイル基、8-ペンタデセン-1, 15-ジイル基、9-ペンタデセン-1,  
15-ジイル基、10-ペンタデセン-1, 15-ジイル基、11-ペンタデセ  
ン-1, 15-ジイル基、12-ペンタデセン-1, 15-ジイル基、13-ペ  
ンタデセン-1, 15-ジイル基、  
20 2-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、3-ヘキサデセン-1, 16-ジイル  
基、4-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、5-ヘキサデセン-1, 16-ジ  
イル基、6-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、7-ヘキサデセン-1, 16  
-ジイル基、8-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、9-ヘキサデセン-1,  
16-ジイル基、10-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、11-ヘキサデセ  
25 ン-1, 16-ジイル基、12-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、13-ヘ  
キサデセン-1, 16-ジイル基、14-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、  
2-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、3-ヘプタデセン-1, 17-ジイル  
基、4-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、5-ヘプタデセン-1, 17-ジ  
イル基、6-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、7-ヘプタデセン-1, 17

- ージル基、8-ヘプタデセン-1, 17-ジル基、9-ヘプタデセン-1,  
17-ジル基、10-ヘプタデセン-1, 17-ジル基、11-ヘプタデセ  
ン-1, 17-ジル基、12-ヘプタデセン-1, 17-ジル基、13-ヘ  
プタデセン-1, 17-ジル基、14-ヘプタデセン-1, 17-ジル基、  
5 15-ヘプタデセン-1, 17-ジル基、  
2-オクタデセン-1, 18-ジル基、3-オクタデセン-1, 18-ジル  
基、4-オクタデセン-1, 18-ジル基、5-オクタデセン-1, 18-ジ  
イル基、6-オクタデセン-1, 18-ジル基、7-オクタデセン-1, 18  
ージル基、8-オクタデセン-1, 18-ジル基、9-オクタデセン-1,  
10 18-ジル基、10-オクタデセン-1, 18-ジル基、11-オクタデセ  
ン-1, 18-ジル基、12-オクタデセン-1, 18-ジル基、13-オ  
クタデセン-1, 18-ジル基、14-オクタデセン-1, 18-ジル基、  
15-オクタデセン-1, 18-ジル基、16-オクタデセン-1, 18-ジ  
イル基、  
15 2-ノナデセン-1, 19-ジル基、3-ノナデセン-1, 19-ジル基、  
4-ノナデセン-1, 19-ジル基、5-ノナデセン-1, 19-ジル基、  
6-ノナデセン-1, 19-ジル基、7-ノナデセン-1, 19-ジル基、  
8-ノナデセン-1, 19-ジル基、9-ノナデセン-1, 19-ジル基、  
10-ノナデセン-1, 19-ジル基、11-ノナデセン-1, 19-ジル  
20 基、12-ノナデセン-1, 19-ジル基、13-ノナデセン-1, 19-ジ  
イル基、14-ノナデセン-1, 19-ジル基、15-ノナデセン-1, 19  
ージル基、16-ノナデセン-1, 19-ジル基、17-ノナデセン-1,  
19-ジル基、  
2-イコセン-1, 20-ジル基、3-イコセン-1, 20-ジル基、4-  
25 イコセン-1, 20-ジル基、5-イコセン-1, 20-ジル基、6-イコ  
セン-1, 20-ジル基、7-イコセン-1, 20-ジル基、8-イコセン  
ー1, 20-ジル基、9-イコセン-1, 20-ジル基、10-イコセン-  
1, 20-ジル基、11-イコセン-1, 20-ジル基、12-イコセン-  
1, 20-ジル基、13-イコセン-1, 20-ジル基、14-イコセン-

1, 20-ジイル基、15-イコセン-1, 20-ジイル基、16-イコセン-  
1, 20-ジイル基、17-イコセン-1, 20-ジイル基、18-イコセン-  
1, 20-ジイル基、

2-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、3-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、

5 4-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、5-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、

6-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、7-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、

8-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、9-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、

10-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、11-ヘニコセン-1, 21-ジイル

基、12-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、13-ヘニコセン-1, 21-ジ

10 イル基、14-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、15-ヘニコセン-1, 21

—ジイル基、16—ヘニコセン—1, 21—ジイル基、17—ヘニコセン—1,

21-ジイル基、18-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、19-ヘニコセン-

1, 2 1-ジイル基、

2-ドコセン-1, 22-ジイル基、3-ドコセン-1, 22-ジイル基、4-

15 ドコセン-1, 22-ジイル基、5-ドコセン-1, 22-ジイル基、6-ドコ

セン-1, 22-ジイル基、7-ドコセン-1, 22-ジイル基、8-ドコセン

— 1, 22-ジイル基、9-ドコセン— 1, 22-ジイル基、10-ドコセン—

1, 22-ジイル基、11-ドコセン-1, 22-ジイル基、12-ドコセン-

1, 2, 2-ジイル基、1, 3-ドコセン-1, 2, 2-ジイル基、1, 4-ドコセン-

20 1, 22-ジイル基、15-ドコセン-1, 22-ジイル基、16-ドコセン-

1, 22-ジイル基、17-ドコセン-1, 22-ジイル基、18-ドコセン-

1, 22-ジイル基、19-ドコセン-1, 22-ジイル基、20-ドコセン-

1, 2, 2-ジイル基、

2-トリコセン-1, 23-ジイル基、3-トリコセン-1, 23-ジイル基、

25 4-トリコセン-1, 23-ジイル基、5-トリコセン-1, 23-ジイル基、

6-トリコセン-1, 23-ジイル基、7-トリコセン-1, 23-ジイル基、

8-トリコセン-1, 23-ジイル基、9-トリコセン-1, 23-ジイル基、

10-トリコセン-1, 23-ジイル基、11-トリコセン-1, 23-ジイル

基、 $1\ 2$ -トリコセン- $1$ 、 $2\ 3$ -ジイル基、 $1\ 3$ -トリコセン- $1$ 、 $2\ 3$ -ジ



- イル基、14-トリコセン-1, 23-ジイル基、15-トリコセン-1, 23-ジイル基、16-トリコセン-1, 23-ジイル基、17-トリコセン-1, 23-ジイル基、18-トリコセン-1, 23-ジイル基、19-トリコセン-1, 23-ジイル基、20-トリコセン-1, 23-ジイル基、21-トリコセン-1, 23-ジイル基、
- 2-テトラコセン-1, 24-ジイル基、3-テトラコセン-1, 24-ジイル基、4-テトラコセン-1, 24-ジイル基、5-テトラコセン-1, 24-ジイル基、6-テトラコセン-1, 24-ジイル基、7-テトラコセン-1, 24-ジイル基、8-テトラコセン-1, 24-ジイル基、9-テトラコセン-1, 24-ジイル基、10-テトラコセン-1, 24-ジイル基、11-テトラコセン-1, 24-ジイル基、12-テトラコセン-1, 24-ジイル基、13-テトラコセン-1, 24-ジイル基、14-テトラコセン-1, 24-ジイル基、15-テトラコセン-1, 24-ジイル基、16-テトラコセン-1, 24-ジイル基、17-テトラコセン-1, 24-ジイル基、18-テトラコセン-1, 24-ジイル基、19-テトラコセン-1, 24-ジイル基、20-テトラコセン-1, 24-ジイル基、21-テトラコセン-1, 24-ジイル基、22-テトラコセン-1, 24-ジイル基、
- 2-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、3-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、4-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、5-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、6-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、7-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、8-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、8-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、9-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、10-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、11-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、12-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、13-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、14-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、15-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、16-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、17-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、18-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、19-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、20-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、21-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、22-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、2

- 3-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、  
2-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、3-ヘキサコセン-1, 26-ジイル  
基、4-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、5-ヘキサコセン-1, 26-ジ  
5 イル基、6-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、7-ヘキサコセン-1, 26  
-ジイル基、8-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、9-ヘキサコセン-1,  
26-ジイル基、10-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、11-ヘキサコセ  
ン-1, 26-ジイル基、12-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、13-ヘ  
キサコセン-1, 26-ジイル基、14-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、  
15-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、16-ヘキサコセン-1, 26-ジ  
10 イル基、17-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、18-ヘキサコセン-1,  
26-ジイル基、19-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、20-ヘキサコセ  
ン-1, 26-ジイル基、21-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、22-ヘ  
キサコセン-1, 26-ジイル基、23-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、  
24-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、  
15 2-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、3-ヘプタコセン-1, 27-ジイル  
基、4-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、5-ヘプタコセン-1, 27-ジ  
イル基、6-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、7-ヘプタコセン-1, 27  
-ジイル基、8-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、9-ヘプタコセン-1,  
27-ジイル基、10-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、11-ヘプタコセ  
20 ン-1, 27-ジイル基、12-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、13-ヘ  
プタコセン-1, 27-ジイル基、14-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、  
15-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、16-ヘプタコセン-1, 27-ジ  
イル基、17-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、18-ヘプタコセン-1,  
27-ジイル基、19-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、20-ヘプタコセ  
25 ン-1, 27-ジイル基、21-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、22-ヘ  
プタコセン-1, 27-ジイル基、23-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、  
24-ヘプタコセン-1, 27-ジイル基、25-ヘプタコセン-1, 27-ジ  
イル基、  
2-オクタコセン-1, 28-ジイル基、3-オクタコセン-1, 28-ジイル

- 基、4-オクタコセン-1, 28-ジイル基、5-オクタコセン-1, 28-ジイル基、6-オクタコセン-1, 28-ジイル基、7-オクタコセン-1, 28-ジイル基、8-オクタコセン-1, 28-ジイル基、9-オクタコセン-1, 28-ジイル基、10-オクタコセン-1, 28-ジイル基、11-オクタコセン-1, 28-ジイル基、12-オクタコセン-1, 28-ジイル基、13-オクタコセン-1, 28-ジイル基、14-オクタコセン-1, 28-ジイル基、15-オクタコセン-1, 28-ジイル基、16-オクタコセン-1, 28-ジイル基、17-オクタコセン-1, 28-ジイル基、18-オクタコセン-1, 28-ジイル基、19-オクタコセン-1, 28-ジイル基、20-オクタコセン-1, 28-ジイル基、21-オクタコセン-1, 28-ジイル基、22-オクタコセン-1, 28-ジイル基、23-オクタコセン-1, 28-ジイル基、24-オクタコセン-1, 28-ジイル基、25-オクタコセン-1, 28-ジイル基、26-オクタコセン-1, 28-ジイル基、2-ノナコセン-1, 29-ジイル基、3-ノナコセン-1, 29-ジイル基、4-ノナコセン-1, 29-ジイル基、5-ノナコセン-1, 29-ジイル基、6-ノナコセン-1, 29-ジイル基、7-ノナコセン-1, 29-ジイル基、8-ノナコセン-1, 29-ジイル基、9-ノナコセン-1, 29-ジイル基、10-ノナコセン-1, 29-ジイル基、11-ノナコセン-1, 29-ジイル基、12-ノナコセン-1, 29-ジイル基、13-ノナコセン-1, 29-ジイル基、14-ノナコセン-1, 29-ジイル基、15-ノナコセン-1, 29-ジイル基、16-ノナコセン-1, 29-ジイル基、17-ノナコセン-1, 29-ジイル基、18-ノナコセン-1, 29-ジイル基、19-ノナコセン-1, 29-ジイル基、20-ノナコセン-1, 29-ジイル基、21-ノナコセン-1, 29-ジイル基、22-ノナコセン-1, 29-ジイル基、23-ノナコセン-1, 29-ジイル基、24-ノナコセン-1, 29-ジイル基、25-ノナコセン-1, 29-ジイル基、26-ノナコセン-1, 29-ジイル基、27-ノナコセン-1, 29-ジイル基、2-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、3-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、4-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、5-トリアコンテン-1,

30-ジイル基、6-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、7-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、8-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、9-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、10-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、11-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、12-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、13-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、14-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、15-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、16-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、17-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、18-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、19-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、20-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、21-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、22-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、23-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、24-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、25-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、26-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、27-トリアコンテン-1, 30-ジイル基、及び28-トリアコンテン-1, 30-ジイル基等の直鎖状のアルケニレン基、  
並びに、1-メチルエチレン-1, 2-ジイル基、2-メチル-1-プロペン-1, 3-ジイル基、2-メチル-2-プロペン-1, 3-ジイル基、2-メチル-1-ブテン-1, 4-ジイル基、3-メチル-2-ブテン-1, 4-ジイル基、2-メチル-3-ブテン-1, 4-ジイル基、2, 3-ジメチル-1, 3-ブタジエン-1, 4-ジイル基、3-エチル-2-プロペン-1, 5-ジイル基、4-メチル-3-プロペン-1, 5-ジイル基、3-メチル-2, 4-プロパジエン-1, 5-ジイル基、3, 4-ジエチル-2-ヘキセン-1, 6-ジイル基、4-メチル-3-ヘキセン-1, 6-ジイル基、2-メチル-4-ヘキセン-1, 6-ジイル基、3, 5-ジメチル-2, 4-ヘキサジエン-1, 6-ジイル基、5-エチル-3-メチル-2-ヘプテン-1, 7-ジイル基、5-メチル-3-ヘプテン-1, 7-ジイル基、4-n-プロピル-4-ヘプテン-1, 7-ジイル基、3, 6-ジメチル-5-ヘプテン-1, 7-ジイル基、5-エチル-2, 4-ヘプタジエン-1, 7-ジイル基、2, 6-ジメチル-2, 5-ヘプタジエン-1, 7-ジイル基、4-エチル-3, 5-ヘプタジエン-1, 7-ジイル基、4-エチル-6, 6-ジメチル-2-オクテン-1, 8-ジイル基、5-

n-プロピル-3-オクテン-1, 8-ジイル基、3-エチル-4-オクテン-1, 8-ジイル基、4-エチル-2-メチル-6-i-プロピル-5-オクテン-1, 8-ジイル基、3, 4, 5-トリメチル-6-オクテン-1, 8-ジイル基、5-エチル-7-メチル-2, 4-オクタジエン-1, 8-ジイル基、3-メチル-2, 5-オクタジエン-1, 8-ジイル基、5-n-プロピル-2, 6-オクタジエン-1, 8-ジイル基、4-メチル-2, 4, 6-オクタトリエン-1, 8-ジイル基、5-エチル-2-ノネン-1, 9-ジイル基、3, 5, 6-トリメチル-3-ノネン-1, 9-ジイル基、2, 4, 5, 7-テトラメチル-4-ノネン-1, 9-ジイル基、3, 4-ジエチル-5-ノネン-1, 9-ジイル基、4-i-プロピル-6-ノネン-1, 9-ジイル基、3-エチル-7-ノネン-1, 9-ジイル基、5-n-ブチル-2-デセン-1, 10-ジイル基、6-i-プロピル-3-デセン-1, 10-ジイル基、5-エチル-4-デセン-1, 10-ジイル基、6, 7-ジメチル-5-デセン-1, 10-ジイル基、4-エチル-6-デセン-1, 10-ジイル基、5-メチル-7-デセン-1, 10-ジイル基、6-エチル-4-メチル-8-デセン-1, 10-ジイル基、

6-メチル-2-ウンデセン-1, 11-ジイル基、4-エチル-3-ウンデセン-1, 11-ジイル基、5-メチル-4-ウンデセン-1, 11-ジイル基、7-エチル-5-ウンデセン-1, 11-ジイル基、5-メチル-6-ウンデセン-1, 11-ジイル基、9-エチル-7-ウンデセン-1, 11-ジイル基、3-メチル-8-ウンデセン-1, 11-ジイル基、4-エチル-9-ウンデセン-1, 11-ジイル基、

4-エチル-2-ドデセン-1, 12-ジイル基、5-メチル-3-ドデセン-1, 12-ジイル基、6-エチル-4-ドデセン-1, 12-ジイル基、7-メチル-5-ドデセン-1, 12-ジイル基、8-エチル-6-ドデセン-1, 12-ジイル基、9-メチル-7-ドデセン-1, 12-ジイル基、10-エチル-8-ドデセン-1, 12-ジイル基、2-メチル-9-ドデセン-1, 12-ジイル基、5-エチル-10-ドデセン-1, 12-ジイル基、4, 7, 9-トリメチル-2-トリデセン-1, 13-ジイル基、10-メチル

- − 3 − トリデセン − 1, 13 − ジイル基、8 − エチル − 4 − トリデセン − 1, 13 − ジイル基、4 − メチル − 5 − トリデセン − 1, 13 − ジイル基、5 − エチル − 6 − トリデセン − 1, 13 − ジイル基、3, 6 − ジエチル − 7 − トリデセン − 1, 13 − ジイル基、5 − メチル − 8 − トリデセン − 1, 13 − ジイル基、7 −
- 5 エチル − 9 − トリデセン − 1, 13 − ジイル基、4 − メチル − 10 − トリデセン − 1, 13 − ジイル基、6 − エチル − 11 − トリデセン − 1, 13 − ジイル基、7 − メチル − 2 − テトラデセン − 1, 14 − ジイル基、8 − エチル − 3 − テトラデセン − 1, 14 − ジイル基、6 − n − プロピル − 4 − テトラデセン − 1, 14 −
- 10 − ジイル基、8 − メチル − 5 − テトラデセン − 1, 14 − ジイル基、3 − エチル − 6 − テトラデセン − 1, 14 − ジイル基、10 − メチル − 7 − テトラデセン − 1, 14 − ジイル基、6 − i − プロピル − 8 − テトラデセン − 1, 14 − ジイル基、5, 7, 11 − トリメチル − 9 − テトラデセン − 1, 14 − ジイル基、5 −
- エチル − 10 − テトラデセン − 1, 14 − ジイル基、6 − メチル − 11 − テトラデセン − 1, 14 − ジイル基、4 − n − ブチル − 12 − テトラデセン − 1, 14 −
- 15 − ジイル基、
- 4 − メチル − 2 − ペンタデセン − 1, 15 − ジイル基、6 − エチル − 3 − ペンタデセン − 1, 15 − ジイル基、8 − メチル − 4 − ペンタデセン − 1, 15 − ジイル基、10 − エチル − 5 − ペンタデセン − 1, 15 − ジイル基、4, 9 − ジメチル − 6 −
- 20 − ペンタデセン − 1, 15 − ジイル基、10 − エチル − 7 − ペンタデセン − 1, 15 − ジイル基、6 − メチル − 8 − ペンタデセン − 1, 15 − ジイル基、8 − n − プロピル − 9 − ペンタデセン − 1, 15 − ジイル基、5 − メチル − 10 −
- ペンタデセン − 1, 15 − ジイル基、4, 7 − ジエチル − 11 − ペンタデセン − 1, 15 − ジイル基、5 − メチル − 12 − ペンタデセン − 1, 15 − ジイル基、8 − エチル − 13 −
- 25 − ペンタデセン − 1, 15 − ジイル基、
- 8 − i − プロピル − 2 − ヘキサデセン − 1, 16 − ジイル基、6 − メチル − 3 − ヘキサデセン − 1, 16 − ジイル基、8 − エチル − 4 − ヘキサデセン − 1, 16 −
- ジイル基、9 − メチル − 5 − ヘキサデセン − 1, 16 − ジイル基、10 − エチル − 6 −
- ヘキサデセン − 1, 16 − ジイル基、5 − メチル − 7 − ヘキサデセン − 1, 16 −
- ジイル基、5, 10 − ジメチル − 8 − ヘキサデセン − 1, 16 −

- イル基、5-エチル-9-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、7, 12-ジエチル-10-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、5-エチル-7-メチル-11-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、5-メチル-12-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、8-s-ブチル-13-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、
- 5、5-エチル-14-ヘキサデセン-1, 16-ジイル基、11-メチル-2-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、9-エチル-3-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、6-i-プロピル-4-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、8-メチル-5-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、4-エチル-6-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、10-メチル-7-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、5, 11-ジメチル-8-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、5-エチル-9-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、8-エチル-10-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、7-メチル-11-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、5-i-プロピル-12-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、9-エチル-13-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、8-メチル-14-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、7-s-ブチル-15-ヘプタデセン-1, 17-ジイル基、
- 10, 15-ジメチル-2-オクタデセン-1, 18-ジイル基、6-エチル-3-オクタデセン-1, 18-ジイル基、10-メチル-4-オクタデセン-1, 18-ジイル基、11-メチル-5-オクタデセン-1, 18-ジイル基、12-エチル-6-オクタデセン-1, 18-ジイル基、10-メチル-7-オクタデセン-1, 18-ジイル基、5-メチル-8-オクタデセン-1, 18-ジイル基、8-エチル-9-オクタデセン-1, 18-ジイル基、7-メチル-10-オクタデセン-1, 18-ジイル基、9-n-ブチル-11-オクタデセン-1, 18-ジイル基、7-メチル-12-オクタデセン-1, 18-ジイル基、
- 20、9-エチル-13-オクタデセン-1, 18-ジイル基、10-i-プロピル-14-オクタデセン-1, 18-ジイル基、7-メチル-15-オクタデセン-1, 18-ジイル基、10-エチル-16-オクタデセン-1, 18-ジイル基、
- 25、10-メチル-2-ノナデセン-1, 19-ジイル基、10, 12-ジエチル-

- 3-ノナデセン-1, 19-ジイル基、6-メチル-4-ノナデセン-1, 19-ジイル基、7-エチル-5-ノナデセン-1, 19-ジイル基、9-n-プロピル-6-ノナデセン-1, 19-ジイル基、10-メチル-7-ノナデセン-1, 19-ジイル基、12-i-プロピル-8-ノナデセン-1, 19-ジイル基、
- 5 15-ジメチル-9-ノナデセン-1, 19-ジイル基、7-エチル-13-メチル-10-ノナデセン-1, 19-ジイル基、6-メチル-11-ノナデセン-1, 19-ジイル基、6-エチル-12-ノナデセン-1, 19-ジイル基、7, 15-ジエチル-13-ノナデセン-1, 19-ジイル基、9-s-ブチル-14-ノナデセン-1, 19-ジイル基、8-メチル-15-ノナデセン-1, 19-ジイル基、10-エチル-16-ノナデセン-1, 19-ジイル基、10-i-プロピル-17-ノナデセン-1, 19-ジイル基、
- 10 8-メチル-2-イコセン-1, 20-ジイル基、6-エチル-3-イコセン-1, 20-ジイル基、10-i-プロピル-4-イコセン-1, 20-ジイル基、11-n-プロピル-5-イコセン-1, 20-ジイル基、12-メチル-6-イコセン-1, 20-ジイル基、11-エチル-7-イコセン-1, 20-ジイル基、13-n-プロピル-8-イコセン-1, 20-ジイル基、8-i-プロピル-9-イコセン-1, 20-ジイル基、8-n-プロピル-10-イコセン-1, 20-ジイル基、7-メチル-11-イコセン-1, 20-ジイル基、
- 15 8-エチル-12-イコセン-1, 20-ジイル基、10-n-プロピル-13-イコセン-1, 20-ジイル基、9-i-プロピル-14-イコセン-1, 20-ジイル基、10-n-ブチル-15-イコセン-1, 20-ジイル基、8-s-ブチル-16-イコセン-1, 20-ジイル基、7-i-ブチル-17-イコセン-1, 20-ジイル基、9-メチル-18-イコセン-1, 20-ジイル基、
- 20 11-メチル-2-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、12-n-ブチル-3-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、10-n-ペンチル-4-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、8-エチル-5-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、10-i-プロピル-6-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、5-n-プロピル-7-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、13-n-ブチル-8-ヘニコセン-1, 21
- 25



- ージイル基、15-s-ブチル-9-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、5-メ  
チル-10-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、15-エチル-6-メチル-1  
1-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、8-エチル-12-ヘニコセン-1, 2  
1-ジイル基、7-メチル-13-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、11-エ  
チル-14-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、6-エチル-15-ヘニコセン  
5 -1, 21-ジイル基、9-メチル-16-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、  
5-エチル-9-メチル-17-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、10, 10  
-ジメチル-18-ヘニコセン-1, 21-ジイル基、9-エチル-19-ヘニ  
コセン-1, 21-ジイル基、  
10 11-メチル-2-ドコセン-1, 22-ジイル基、12-エチル-3-ドコセ  
ン-1, 22-ジイル基、13-i-プロピル-4-ドコセン-1, 22-ジイ  
ル基、10-n-プロピル-5-ドコセン-1, 22-ジイル基、10-n-ブ  
チル-6-ドコセン-1, 22-ジイル基、15-s-ブチル-7-ドコセン-  
1, 22-ジイル基、11-i-ブチル-8-ドコセン-1, 22-ジイル基、  
15 5, 15-ジメチル-9-ドコセン-1, 22-ジイル基、8, 14-ジエチル  
-10-ドコセン-1, 22-ジイル基、5-メチル-11-ドコセン-1, 2  
2-ジイル基、7-エチル-12-ドコセン-1, 22-ジイル基、10-メチ  
ル-13-ドコセン-1, 22-ジイル基、10-エチル-14-ドコセン-1  
, 22-ジイル基、9-エチル-15-ドコセン-1, 22-ジイル基、8-メ  
チル-16-ドコセン-1, 22-ジイル基、7-i-プロピル-17-ドコセ  
20 -1, 22-ジイル基、10-i-ブチル-18-ドコセン-1, 22-ジイ  
ル基、9, 10-ジメチル-19-ドコセン-1, 22-ジイル基、13-エチ  
ル-20-ドコセン-1, 22-ジイル基、  
19-メチル-2-トリコセン-1, 23-ジイル基、10, 15-ジメチル-  
25 3-トリコセン-1, 23-ジイル基、3, 11, 16-トリメチル-4-トリ  
コセン-1, 23-ジイル基、12-エチル-5-トリコセン-1, 23-ジイ  
ル基、6, 13-ジエチル-6-トリコセン-1, 23-ジイル基、4, 12,  
18-トリエチル-7-トリコセン-1, 23-ジイル基、18-i-プロピル  
-8-トリコセン-1, 23-ジイル基、14-n-プロピル-9-トリコセン

- 1, 23-ジイル基、8-n-ブチル-10-トリコセン-1, 23-ジイル  
 基、15-s-ブチル-11-トリコセン-1, 23-ジイル基、5-i-ブチ  
 ル-12-トリコセン-1, 23-ジイル基、7-エチル-9-メチル-13-  
 トリコセン-1, 23-ジイル基、9-メチル-14-トリコセン-1, 23-  
 5 ジイル基、4, 18-ジメチル-15-トリコセン-1, 23-ジイル基、3,  
 4, 11-トリメチル-16-トリコセン-1, 23-ジイル基、9-エチル-  
 17-トリコセン-1, 23-ジイル基、10, 13-ジエチル-18-トリコ  
 セン-1, 23-ジイル基、5, 8, 21-トリエチル-19-トリコセン-1  
 , 23-ジイル基、15-i-プロピル-20-トリコセン-1, 23-ジイル  
 10 基、17-n-プロピル-21-トリコセン-1, 23-ジイル基、  
 16-n-ブチル-2-テトラコセン-1, 24-ジイル基、11-s-ブチル  
 -3-テトラコセン-1, 24-ジイル基、8-i-ブチル-4-テトラコセン  
 -1, 24-ジイル基、18-エチル-9-メチル-5-テトラコセン-1, 2  
 4-ジイル基、13-メチル-6-テトラコセン-1, 24-ジイル基、4, 1  
 15 9-ジメチル-7-テトラコセン-1, 24-ジイル基、5, 10, 17-トリ  
 エチル-8-テトラコセン-1, 24-ジイル基、6-エチル-9-テトラコセ  
 ン-1, 24-ジイル基、7, 16-ジエチル-10-テトラコセン-1, 24  
 -ジイル基、5, 9, 18-トリエチル-11-テトラコセン-1, 24-ジイ  
 ル基、10-n-プロピル-12-テトラコセン-1, 24-ジイル基、20-  
 20 i-プロピル-13-テトラコセン-1, 24-ジイル基、9-n-ブチル-1  
 4-テトラコセン-1, 24-ジイル基、11-s-ブチル-15-テトラコセ  
 ン-1, 24-ジイル基、13-i-ブチル-16-テトラコセン-1, 24-  
 ジイル基、10-エチル-13-メチル-17-テトラコセン-1, 24-ジイ  
 ル基、6-メチル-18-テトラコセン-1, 24-ジイル基、5, 7-ジメチ  
 25 ル-19-テトラコセン-1, 24-ジイル基、4, 8, 13-トリメチル-2  
 0-テトラコセン-1, 24-ジイル基、18-エチル-21-テトラコセン-  
 1, 24-ジイル基、6, 10-ジエチル-22-テトラコセン-1, 24-ジ  
 イル基、  
 9, 13, 16-トリメチル-2-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、12-

- n-プロピル-3-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、11-i-プロピル-4-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、20-n-ブチル-5-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、17-i-ブチル-6-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、15-s-ブチル-7-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、15-エチル-23-メチル-8-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、11-メチル-8-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、13, 17-ジメチル-9-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、5, 8, 21-トリメチル-10-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、17-エチル-11-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、8, 18-ジエチル-12-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、10, 15, 18-トリメチル-13-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、4-n-プロピル-14-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、20-i-プロピル-15-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、8-n-ブチル-16-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、11-s-ブチル-17-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、5, 22-ジメチル-18-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、5-i-ブチル-19-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、9-メチル-13-エチル-20-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、15-メチル-21-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、6, 13-ジメチル-22-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、4, 8, 12-トリメチル-23-ペンタコセン-1, 25-ジイル基、
- 13-エチル-2-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、5, 16-ジエチル-3-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、7, 11, 16-トリメチル-4-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、12-n-プロピル-5-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、21-i-プロピル-6-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、6-n-ブチル-7-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、13-s-ブチル-8-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、19-i-ブチル-9-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、13-エチル-18-メチル-10-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、10-メチル-11-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、10, 20-ジメチル-12-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、7, 9, 17-トリメチル-13-ヘキサコセン-1, 26-ジイル基、8-エチル-

- 1 4-ヘキサコセン-1, 2 6-ジイル基、5, 2 2-ジエチル-1 5-ヘキサ  
コセン-1, 2 6-ジイル基、7, 1 0, 2 1-トリメチル-1 6-ヘキサコセ  
ン-1, 2 6-ジイル基、1 5-n-プロピル-1 7-ヘキサコセン-1, 2 6  
-ジイル基、1 3-i-プロピル-1 8-ヘキサコセン-1, 2 6-ジイル基、  
5 8-n-ブチル-1 9-ヘキサコセン-1, 2 6-ジイル基、1 1-s-ブチル  
-2 0-ヘキサコセン-1, 2 6-ジイル基、1 4-i-ブチル-2 1-ヘキサ  
コセン-1, 2 6-ジイル基、5-エチル-2 1-メチル-2 2-ヘキサコセン  
-1, 2 6-ジイル基、7-メチル-2 3-ヘキサコセン-1, 2 6-ジイル基  
、8, 1 4-ジメチル-2 4-ヘキサコセン-1, 2 6-ジイル基、  
10 7, 1 6, 2 4-トリメチル-2-ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、9-エ  
チル-3-ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、7, 1 6-ジメチル-4-ヘプ  
タコセン-1, 2 7-ジイル基、9, 1 3, 2 1-トリメチル-5-ヘプタコセ  
ン-1, 2 7-ジイル基、1 3-n-プロピル-6-ヘプタコセン-1, 2 7-  
ジイル基、1 0-i-プロピル-7-ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、1 6  
15 -n-プロピル-8-ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、1 8-メチル-9-  
ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、9-i-プロピル-1 0-ヘプタコセン-  
1, 2 7-ジイル基、1 5-エチル-7-メチル-1 1-ヘプタコセン-1, 2  
7-ジイル基、2 5-メチル-1 2-ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、8,  
2 1-ジメチル-1 3-ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、5, 1 1, 2 3-  
20 トリメチル-1 4-ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、9-エチル-1 5-ヘ  
プタコセン-1, 2 7-ジイル基、8, 2 0-ジメチル-1 6-ヘプタコセン-  
1, 2 7-ジイル基、4, 8, 1 9-トリメチル-1 7-ヘプタコセン-1, 2  
7-ジイル基、7-n-プロピル-1 8-ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、  
2 1-i-プロピル-1 9-ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、1 4-n-ブ  
25 ロピル-2 0-ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、8-エチル-2 1-ヘプタ  
コセン-1, 2 7-ジイル基、1 1-i-プロピル-2 2-ヘプタコセン-1,  
2 7-ジイル基、5-エチル-1 3-メチル-2 3-ヘプタコセン-1, 2 7-  
ジイル基、1 6-メチル-2 4-ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、7-エチ  
ル-2 5-ヘプタコセン-1, 2 7-ジイル基、

- 1 4-エチル-2-オクタコセン-1, 28-ジイル基、20-メチル-3-オ  
クタコセン-1, 28-ジイル基、7, 22-ジメチル-4-オクタコセン-1  
, 28-ジイル基、19-エチル-5-オクタコセン-1, 28-ジイル基、1  
1-メチル-6-オクタコセン-1, 28-ジイル基、13, 16-ジメチル-  
5 7-オクタコセン-1, 28-ジイル基、13-エチル-8-オクタコセン-1  
, 28-ジイル基、6-メチル-9-オクタコセン-1, 28-ジイル基、9,  
16-ジメチル-10-オクタコセン-1, 28-ジイル基、7-エチル-11  
-オクタコセン-1, 28-ジイル基、16-メチル-12-オクタコセン-1  
, 28-ジイル基、6, 15-ジメチル-13-オクタコセン-1, 28-ジイ  
10 ル基、22-エチル-14-オクタコセン-1, 28-ジイル基、6-メチル-  
15-オクタコセン-1, 28-ジイル基、8, 11-ジメチル-16-オクタ  
コセン-1, 28-ジイル基、23-エチル-17-オクタコセン-1, 28-  
ジイル基、4-メチル-18-オクタコセン-1, 28-ジイル基、7, 14-  
ジメチル-19-オクタコセン-1, 28-ジイル基、13-エチル-20-オ  
15 クタコセン-1, 28-ジイル基、8-メチル-21-オクタコセン-1, 28  
-ジイル基、11, 17-ジメチル-22-オクタコセン-1, 28-ジイル基  
, 10-エチル-23-オクタコセン-1, 28-ジイル基、9-メチル-24  
-オクタコセン-1, 28-ジイル基、7, 19-ジメチル-25-オクタコセ  
ン-1, 28-ジイル基、12-エチル-26-オクタコセン-1, 28-ジイ  
20 ル基、  
15-メチル-2-ノナコセン-1, 29-ジイル基、14-メチル-3-ノナ  
コセン-1, 29-ジイル基、12-メチル-4-ノナコセン-1, 29-ジイ  
ル基、13-メチル-5-ノナコセン-1, 29-ジイル基、11-メチル-6  
-ノナコセン-1, 29-ジイル基、10-メチル-7-ノナコセン-1, 29  
25 -ジイル基、25-メチル-8-ノナコセン-1, 29-ジイル基、24-メチ  
ル-9-ノナコセン-1, 29-ジイル基、23-メチル-10-ノナコセン-  
1, 29-ジイル基、22-メチル-11-ノナコセン-1, 29-ジイル基、  
21-メチル-12-ノナコセン-1, 29-ジイル基、20-メチル-13-  
ノナコセン-1, 29-ジイル基、19-メチル-14-ノナコセン-1, 29

ージイル基、18-メチル-15-ノナコセン-1, 29-ジイル基、27-メチル-16-ノナコセン-1, 29-ジイル基、26-メチル-17-ノナコセン-1, 29-ジイル基、25-メチル-18-ノナコセン-1, 29-ジイル基、24-メチル-19-ノナコセン-1, 29-ジイル基、23-メチル-20-ノナコセン-1, 29-ジイル基、20-メチル-21-ノナコセン-1, 29-ジイル基、19-メチル-22-ノナコセン-1, 29-ジイル基、18-メチル-23-ノナコセン-1, 29-ジイル基、17-メチル-24-ノナコセン-1, 29-ジイル基、16-メチル-25-ノナコセン-1, 29-ジイル基、6-メチル-26-ノナコセン-1, 29-ジイル基、及び5-メチル-27-ノナコセン-1, 29-ジイル基等の分岐鎖状のアルケニレン基が挙げられる。

Gにおける、置換されていてもよい炭素数2~30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基の、炭素数2~30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基としては、アセチレン-1, 2-ジイル基、1-プロピン-1, 3-ジイル基、2-プロピン-1, 3-ジイル基、1-ブチン-1, 4-ジイル基、2-ブチン-1, 4-ジイル基、3-ブチン-1, 4-ジイル基、1, 3-ブタジイン-1, 4-ジイル基、2-ペンチン-1, 5-ジイル基、3-ペンチン-1, 5-ジイル基、2, 4-ペンタジイン-1, 5-ジイル基、2-ヘキシン-1, 6-ジイル基、3-ヘキシン-1, 6-ジイル基、4-ヘキシン-1, 6-ジイル基、2, 4-ヘキサジイン-1, 6-ジイル基、2-ヘプチン-1, 7-ジイル基、3-ヘプチン-1, 7-ジイル基、4-ヘプチン-1, 7-ジイル基、5-ヘプチン-1, 7-ジイル基、2, 4-ヘプタジイン-1, 7-ジイル基、2, 5-ヘプタジイン-1, 7-ジイル基、3, 5-ヘプタジイン-1, 7-ジイル基、2-オクチン-1, 8-ジイル基、3-オクチン-1, 8-ジイル基、4-オクチン-1, 8-ジイル基、5-オクチン-1, 8-ジイル基、6-オクチン-1, 8-ジイル基、2, 4-オクタジイン-1, 8-ジイル基、2, 5-オクタジイン-1, 8-ジイル基、2, 6-オクタジイン-1, 8-ジイル基、2, 4, 6-オクタトリイン-1, 8-ジイル基、2-ノニン-1, 9-ジイル基、3-ノニン-1, 9-ジイル基、4-ノニン-1, 9-ジイル基、5-ノニン-1, 9

- ージイル基、6-ノニン-1, 9-ジイル基、7-ノニン-1, 9-ジイル基、  
2-デシン-1, 10-ジイル基、3-デシン-1, 10-ジイル基、4-デシ  
ン-1, 10-ジイル基、5-デシン-1, 10-ジイル基、6-デシン-1,  
10-ジイル基、7-デシン-1, 10-ジイル基、8-デシン-1, 10-ジ  
5 イル基、  
2-ウンデシン-1, 11-ジイル基、3-ウンデシン-1, 11-ジイル基、  
4-ウンデシン-1, 11-ジイル基、5-ウンデシン-1, 11-ジイル基、  
6-ウンデシン-1, 11-ジイル基、7-ウンデシン-1, 11-ジイル基、  
8-ウンデシン-1, 11-ジイル基、9-ウンデシン-1, 11-ジイル基、  
10 2-ドデシン-1, 12-ジイル基、3-ドデシン-1, 12-ジイル基、4-  
ドデシン-1, 12-ジイル基、5-ドデシン-1, 12-ジイル基、6-ドデ  
シン-1, 12-ジイル基、7-ドデシン-1, 12-ジイル基、8-ドデシ  
ン-1, 12-ジイル基、9-ドデシン-1, 12-ジイル基、10-ドデシン-  
1, 12-ジイル基、  
15 2-トリデシン-1, 13-ジイル基、3-トリデシン-1, 13-ジイル基、  
4-トリデシン-1, 13-ジイル基、5-トリデシン-1, 13-ジイル基、  
6-トリデシン-1, 13-ジイル基、7-トリデシン-1, 13-ジイル基、  
8-トリデシン-1, 13-ジイル基、9-トリデシン-1, 13-ジイル基、  
10-トリデシン-1, 13-ジイル基、11-トリデシン-1, 13-ジイル  
20 基、  
2-テトラデシン-1, 14-ジイル基、3-テトラデシン-1, 14-ジイル  
基、4-テトラデシン-1, 14-ジイル基、5-テトラデシン-1, 14-ジ  
イル基、6-テトラデシン-1, 14-ジイル基、7-テトラデシン-1, 14  
-ジイル基、8-テトラデシン-1, 14-ジイル基、9-テトラデシン-1,  
14-ジイル基、10-テトラデシン-1, 14-ジイル基、11-テトラデシ  
25 ン-1, 14-ジイル基、12-テトラデシン-1, 14-ジイル基、  
2-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、3-ペンタデシン-1, 15-ジイル  
基、4-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、5-ペンタデシン-1, 15-ジ  
イル基、6-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、7-ペンタデシン-1, 15

ージイル基、8-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、9-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、10-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、11-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、12-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、13-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、

- 5 2-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、3-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、4-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、5-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、6-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、7-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、8-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、9-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、10-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、11-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、12-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、13-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、14-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、
- 10 2-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、3-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、4-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、5-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、6-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、7-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、8-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、9-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、10-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、11-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、12-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、13-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、14-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、
- 15 15-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、
- 20 2-オクタデシン-1, 18-ジイル基、3-オクタデシン-1, 18-ジイル基、4-オクタデシン-1, 18-ジイル基、5-オクタデシン-1, 18-ジイル基、6-オクタデシン-1, 18-ジイル基、7-オクタデシン-1, 18-ジイル基、8-オクタデシン-1, 18-ジイル基、9-オクタデシン-1, 18-ジイル基、10-オクタデシン-1, 18-ジイル基、11-オクタデシン-1, 18-ジイル基、12-オクタデシン-1, 18-ジイル基、13-オクタデシン-1, 18-ジイル基、14-オクタデシン-1, 18-ジイル基、
- 25 15-オクタデシン-1, 18-ジイル基、16-オクタデシン-1, 18-ジイル基、
- 2-ノナデシン-1, 19-ジイル基、3-ノナデシン-1, 19-ジイル基、



- 4-ノナデシン-1, 19-ジイル基、5-ノナデシン-1, 19-ジイル基、  
6-ノナデシン-1, 19-ジイル基、7-ノナデシン-1, 19-ジイル基、  
8-ノナデシン-1, 19-ジイル基、9-ノナデシン-1, 19-ジイル基、  
10-ノナデシン-1, 19-ジイル基、11-ノナデシン-1, 19-ジイル  
5 基、12-ノナデシン-1, 19-ジイル基、13-ノナデシン-1, 19-ジ  
イル基、14-ノナデシン-1, 19-ジイル基、15-ノナデシン-1, 19  
-ジイル基、16-ノナデシン-1, 19-ジイル基、17-ノナデシン-1,  
19-ジイル基、  
2-イコシン-1, 20-ジイル基、3-イコシン-1, 20-ジイル基、4-  
10 イコシン-1, 20-ジイル基、5-イコシン-1, 20-ジイル基、6-イコ  
シン-1, 20-ジイル基、7-イコシン-1, 20-ジイル基、8-イコシン  
-1, 20-ジイル基、9-イコシン-1, 20-ジイル基、10-イコシン-  
1, 20-ジイル基、11-イコシン-1, 20-ジイル基、12-イコシン-  
1, 20-ジイル基、13-イコシン-1, 20-ジイル基、14-イコシン-  
15 1, 20-ジイル基、15-イコシン-1, 20-ジイル基、16-イコシン-  
1, 20-ジイル基、17-イコシン-1, 20-ジイル基、18-イコシン-  
1, 20-ジイル基、  
2-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、3-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、  
4-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、5-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、  
20 6-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、7-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、  
8-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、9-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、  
10-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、11-ヘニコシン-1, 21-ジイル  
基、12-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、13-ヘニコシン-1, 21-ジ  
イル基、14-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、15-ヘニコシン-1, 21  
-ジイル基、16-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、17-ヘニコシン-1,  
25 21-ジイル基、18-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、19-ヘニコシン-  
1, 21-ジイル基、  
2-ドコシン-1, 22-ジイル基、3-ドコシン-1, 22-ジイル基、4-  
ドコシン-1, 22-ジイル基、5-ドコシン-1, 22-ジイル基、6-ドコ

- シン-1, 22-ジイル基、7-ドコシン-1, 22-ジイル基、8-ドコシン-1, 22-ジイル基、9-ドコシン-1, 22-ジイル基、10-ドコシン-1, 22-ジイル基、11-ドコシン-1, 22-ジイル基、12-ドコシン-1, 22-ジイル基、13-ドコシン-1, 22-ジイル基、14-ドコシン-1, 22-ジイル基、15-ドコシン-1, 22-ジイル基、16-ドコシン-1, 22-ジイル基、17-ドコシン-1, 22-ジイル基、18-ドコシン-1, 22-ジイル基、19-ドコシン-1, 22-ジイル基、20-ドコシン-1, 22-ジイル基、
- 2-トリコシン-1, 23-ジイル基、3-トリコシン-1, 23-ジイル基、4-トリコシン-1, 23-ジイル基、5-トリコシン-1, 23-ジイル基、6-トリコシン-1, 23-ジイル基、7-トリコシン-1, 23-ジイル基、8-トリコシン-1, 23-ジイル基、9-トリコシン-1, 23-ジイル基、10-トリコシン-1, 23-ジイル基、11-トリコシン-1, 23-ジイル基、12-トリコシン-1, 23-ジイル基、13-トリコシン-1, 23-ジイル基、14-トリコシン-1, 23-ジイル基、15-トリコシン-1, 23-ジイル基、16-トリコシン-1, 23-ジイル基、17-トリコシン-1, 23-ジイル基、18-トリコシン-1, 23-ジイル基、19-トリコシン-1, 23-ジイル基、20-トリコシン-1, 23-ジイル基、21-トリコシン-1, 23-ジイル基、
- 2-テトラコシン-1, 24-ジイル基、3-テトラコシン-1, 24-ジイル基、4-テトラコシン-1, 24-ジイル基、5-テトラコシン-1, 24-ジイル基、6-テトラコシン-1, 24-ジイル基、7-テトラコシン-1, 24-ジイル基、8-テトラコシン-1, 24-ジイル基、9-テトラコシン-1, 24-ジイル基、10-テトラコシン-1, 24-ジイル基、11-テトラコシン-1, 24-ジイル基、12-テトラコシン-1, 24-ジイル基、13-テトラコシン-1, 24-ジイル基、14-テトラコシン-1, 24-ジイル基、15-テトラコシン-1, 24-ジイル基、16-テトラコシン-1, 24-ジイル基、17-テトラコシン-1, 24-ジイル基、18-テトラコシン-1, 24-ジイル基、19-テトラコシン-1, 24-ジイル基、20-テトラコシ

- ン-1, 24-ジイル基、21-テトラコシン-1, 24-ジイル基、22-テ  
トラコシン-1, 24-ジイル基、  
2-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、3-ペンタコシン-1, 25-ジイル  
基、4-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、5-ペンタコシン-1, 25-ジ  
5 イル基、6-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、7-ペンタコシン-1, 25  
-ジイル基、8-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、8-ペンタコシン-1,  
25-ジイル基、9-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、10-ペンタコシン  
-1, 25-ジイル基、11-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、12-ペン  
タコシン-1, 25-ジイル基、13-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、1  
10 4-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、15-ペンタコシン-1, 25-ジイ  
ル基、16-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、17-ペンタコシン-1, 2  
5-ジイル基、18-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、19-ペンタコシン  
-1, 25-ジイル基、20-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、21-ペン  
タコシン-1, 25-ジイル基、22-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、2  
15 3-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、  
2-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、3-ヘキサコシン-1, 26-ジイル  
基、4-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、5-ヘキサコシン-1, 26-ジ  
イル基、6-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、7-ヘキサコシン-1, 26  
-ジイル基、8-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、9-ヘキサコシン-1,  
20 26-ジイル基、10-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、11-ヘキサコシ  
ン-1, 26-ジイル基、12-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、13-ヘ  
キサコシン-1, 26-ジイル基、14-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、  
15-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、16-ヘキサコシン-1, 26-ジ  
イル基、17-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、18-ヘキサコシン-1,  
25 26-ジイル基、19-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、20-ヘキサコシ  
ン-1, 26-ジイル基、21-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、22-ヘ  
キサコシン-1, 26-ジイル基、23-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、  
24-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、  
2-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、3-ヘプタコシン-1, 27-ジイル

- 基、4-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、5-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、6-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、7-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、8-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、9-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、10-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、11-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、12-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、13-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、14-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、15-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、16-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、17-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、18-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、19-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、20-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、21-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、22-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、23-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、24-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、25-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、
- 2-オクタコシン-1, 28-ジイル基、3-オクタコシン-1, 28-ジイル基、4-オクタコシン-1, 28-ジイル基、5-オクタコシン-1, 28-ジイル基、6-オクタコシン-1, 28-ジイル基、7-オクタコシン-1, 28-ジイル基、8-オクタコシン-1, 28-ジイル基、9-オクタコシン-1, 28-ジイル基、10-オクタコシン-1, 28-ジイル基、11-オクタコシン-1, 28-ジイル基、12-オクタコシン-1, 28-ジイル基、13-オクタコシン-1, 28-ジイル基、14-オクタコシン-1, 28-ジイル基、15-オクタコシン-1, 28-ジイル基、16-オクタコシン-1, 28-ジイル基、17-オクタコシン-1, 28-ジイル基、18-オクタコシン-1, 28-ジイル基、19-オクタコシン-1, 28-ジイル基、20-オクタコシン-1, 28-ジイル基、21-オクタコシン-1, 28-ジイル基、22-オクタコシン-1, 28-ジイル基、23-オクタコシン-1, 28-ジイル基、24-オクタコシン-1, 28-ジイル基、25-オクタコシン-1, 28-ジイル基、26-オクタコシン-1, 28-ジイル基、
- 2-ノナコシン-1, 29-ジイル基、3-ノナコシン-1, 29-ジイル基、4-ノナコシン-1, 29-ジイル基、5-ノナコシン-1, 29-ジイル基、

6-ノナコシン-1, 29-ジイル基、7-ノナコシン-1, 29-ジイル基、  
8-ノナコシン-1, 29-ジイル基、9-ノナコシン-1, 29-ジイル基、  
10-ノナコシン-1, 29-ジイル基、11-ノナコシン-1, 29-ジイル  
5 基、12-ノナコシン-1, 29-ジイル基、13-ノナコシン-1, 29-ジ  
イル基、14-ノナコシン-1, 29-ジイル基、15-ノナコシン-1, 29  
-ジイル基、16-ノナコシン-1, 29-ジイル基、17-ノナコシン-1,  
29-ジイル基、18-ノナコシン-1, 29-ジイル基、19-ノナコシン-  
1, 29-ジイル基、20-ノナコシン-1, 29-ジイル基、21-ノナコシ  
ン-1, 29-ジイル基、22-ノナコシン-1, 29-ジイル基、23-ノナ  
10 コシン-1, 29-ジイル基、24-ノナコシン-1, 29-ジイル基、25-  
ノナコシン-1, 29-ジイル基、26-ノナコシン-1, 29-ジイル基、2  
7-ノナコシン-1, 29-ジイル基、  
2-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、3-トリアコンチン-1, 30-ジ  
イル基、4-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、5-トリアコンチン-1,  
15 30-ジイル基、6-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、7-トリアコンチ  
ン-1, 30-ジイル基、8-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、9-トリ  
アコンチン-1, 30-ジイル基、10-トリアコンチン-1, 30-ジイル基  
、11-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、12-トリアコンチン-1, 3  
0-ジイル基、13-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、14-トリアコン  
20 チン-1, 30-ジイル基、15-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、16  
-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、17-トリアコンチン-1, 30-ジ  
イル基、18-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、19-トリアコンチン-  
1, 30-ジイル基、20-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、21-トリ  
アコンチン-1, 30-ジイル基、22-トリアコンチン-1, 30-ジイル基  
25 、23-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、24-トリアコンチン-1, 3  
0-ジイル基、25-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、26-トリアコン  
チン-1, 30-ジイル基、27-トリアコンチン-1, 30-ジイル基、及び  
28-トリアコンチン-1, 30-ジイル基等の直鎖状のアルキニレン基、  
並びに、3-メチル-1-ブチン-1, 4-ジイル基、2-メチル-3-ブチン

- 1, 4-ジイル基、4-メチル-2-ペンチン-1, 5-ジイル基、2-メチル-3-ペンチン-1, 5-ジイル基、4-エチル-2-ヘキシン-1, 6-ジイル基、5-メチル-3-ヘキシン-1, 6-ジイル基、2-メチル-4-ヘキシン-1, 6-ジイル基、5-エチル-6-メチル-2-ヘプチン-1, 7-ジイル基、5-メチル-3-ヘプチン-1, 7-ジイル基、3-n-プロピル-4-ヘプチン-1, 7-ジイル基、4, 4-ジメチル-5-ヘプチン-1, 7-ジイル基、6-メチル-2, 4-ヘプタジイン-1, 7-ジイル基、4-メチル-2, 5-ヘプタジイン-1, 7-ジイル基、2-メチル-3, 5-ヘプタジイン-1, 7-ジイル基、4-エチル-6, 6-ジメチル-2-オクチン-1, 8-ジイル基、5-n-プロピル-3-オクチン-1, 8-ジイル基、3-エチル-4-オクチン-1, 8-ジイル基、4-エチル-2-メチル-5-オクチン-1, 8-ジイル基、3, 4, 5-トリメチル-6-オクチン-1, 8-ジイル基、7-メチル-2, 4-オクタジイン-1, 8-ジイル基、4-メチル-2, 5-オクタジイン-1, 8-ジイル基、5-n-プロピル-2, 6-オクタジイン-1, 8-ジイル基、5-エチル-2-ノニン-1, 9-ジイル基、5, 6, 7-トリメチル-3-ノニン-1, 9-ジイル基、2, 3, 6, 7-テトラメチル-4-ノニン-1, 9-ジイル基、3, 4-ジエチル-5-ノニン-1, 9-ジイル基、4-i-プロピル-6-ノニン-1, 9-ジイル基、3-エチル-7-ノニン-1, 9-ジイル基、5-n-ブチル-2-デシン-1, 10-ジイル基、6-i-プロピル-3-デシン-1, 10-ジイル基、7-エチル-4-デシン-1, 10-ジイル基、3, 7-ジメチル-5-デシン-1, 10-ジイル基、4-エチル-6-デシン-1, 10-ジイル基、5-メチル-7-デシン-1, 10-ジイル基、6-エチル-4-メチル-8-デシン-1, 10-ジイル基、6-メチル-2-ウンデシン-1, 11-ジイル基、6-エチル-3-ウンデシン-1, 11-ジイル基、7-メチル-4-ウンデシン-1, 11-ジイル基、7-エチル-5-ウンデシン-1, 11-ジイル基、5-メチル-6-ウンデシン-1, 11-ジイル基、9-エチル-7-ウンデシン-1, 11-ジイル基、3-メチル-8-ウンデシン-1, 11-ジイル基、4-エチル-9-ウンデシン-1, 11-ジイル基、

- 5-エチル-2-ドデシン-1, 12-ジイル基、6-メチル-3-ドデシン-1, 12-ジイル基、8-エチル-4-ドデシン-1, 12-ジイル基、8-メチル-5-ドデシン-1, 12-ジイル基、9-エチル-6-ドデシン-1, 12-ジイル基、6-メチル-7-ドデシン-1, 12-ジイル基、10-エチル-8-ドデシン-1, 12-ジイル基、2-メチル-9-ドデシン-1, 12-ジイル基、5-エチル-10-ドデシン-1, 12-ジイル基、4, 7, 9-トリメチル-2-トリデシン-1, 13-ジイル基、10-メチル-3-トリデシン-1, 13-ジイル基、8-エチル-4-トリデシン-1, 13-ジイル基、4-メチル-5-トリデシン-1, 13-ジイル基、5-エチル-6-トリデシン-1, 13-ジイル基、3, 6-ジエチル-7-トリデシン-1, 13-ジイル基、5-メチル-8-トリデシン-1, 13-ジイル基、7-エチル-9-トリデシン-1, 13-ジイル基、4-メチル-10-トリデシン-1, 13-ジイル基、6-エチル-11-トリデシン-1, 13-ジイル基、7-メチル-2-テトラデシン-1, 14-ジイル基、8-エチル-3-テトラデシン-1, 14-ジイル基、6-n-プロピル-4-テトラデシン-1, 14-ジイル基、8-メチル-5-テトラデシン-1, 14-ジイル基、3-エチル-6-テトラデシン-1, 14-ジイル基、10-メチル-7-テトラデシン-1, 14-ジイル基、6-i-プロピル-8-テトラデシン-1, 14-ジイル基、5, 7, 11-トリメチル-9-テトラデシン-1, 14-ジイル基、5-エチル-10-テトラデシン-1, 14-ジイル基、6-メチル-11-テトラデシン-1, 14-ジイル基、4-n-ブチル-12-テトラデシン-1, 14-ジイル基、4-メチル-2-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、6-エチル-3-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、8-メチル-4-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、10-エチル-5-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、4, 9-ジメチル-6-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、10-エチル-7-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、6-メチル-8-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、8-n-プロピル-9-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、5-メチル-10-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、4, 7-ジエチル-11-ペンタデシン

- ー1, 15-ジイル基、5-メチル-12-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、  
8-エチル-13-ペンタデシン-1, 15-ジイル基、  
8-*i*-プロピル-2-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、6-メチル-3-  
ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、8-エチル-4-ヘキサデシン-1, 16-  
5 ジイル基、9-メチル-5-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、10-エチル-6-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、5-メチル-7-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、5, 11-ジメチル-8-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、5-エチル-9-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、7, 13-ジエチル-10-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、5-エチル-7-メチル-11-  
10 ーヘキサデシン-1, 16-ジイル基、5-メチル-12-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、8-*s*-ブチル-13-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、5-エチル-14-ヘキサデシン-1, 16-ジイル基、  
11-メチル-2-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、9-エチル-3-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、7-*i*-プロピル-4-ヘプタデシン-1, 17-  
15 ジイル基、8-メチル-5-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、4-エチル-6-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、10-メチル-7-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、5, 11-ジメチル-8-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、5-エチル-9-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、8-エチル-10-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、7-メチル-11-ヘプタデシン-1  
20 , 17-ジイル基、5-*i*-プロピル-12-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、9-エチル-13-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、8-メチル-14-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、7-*s*-ブチル-15-ヘプタデシン-1, 17-ジイル基、  
10, 15-ジメチル-2-オクタデシン-1, 18-ジイル基、6-エチル-3-オクタデシン-1, 18-ジイル基、10-メチル-4-オクタデシン-1, 18-ジイル基、11-メチル-5-オクタデシン-1, 18-ジイル基、12-エチル-6-オクタデシン-1, 18-ジイル基、10-メチル-7-オクタデシン-1, 18-ジイル基、5-メチル-8-オクタデシン-1, 18-ジイル基、7-エチル-9-オクタデシン-1, 18-ジイル基、7-メチル-1



0-オクタデシン-1, 18-ジイル基、8-n-ブチル-11-オクタデシン-1, 18-ジイル基、7-メチル-12-オクタデシン-1, 18-ジイル基、9-エチル-13-オクタデシン-1, 18-ジイル基、10-i-プロピル-14-オクタデシン-1, 18-ジイル基、7-メチル-15-オクタデシン-1, 18-ジイル基、10-エチル-16-オクタデシン-1, 18-ジイル基、

10-メチル-2-ノナデシン-1, 19-ジイル基、10, 12-ジエチル-3-ノナデシン-1, 19-ジイル基、7-メチル-4-ノナデシン-1, 19-ジイル基、9-エチル-5-ノナデシン-1, 19-ジイル基、9-n-プロピル-6-ノナデシン-1, 19-ジイル基、10-メチル-7-ノナデシン-1, 19-ジイル基、12-i-プロピル-8-ノナデシン-1, 19-ジイル基、5, 15-ジメチル-9-ノナデシン-1, 19-ジイル基、7-エチル-13-メチル-10-ノナデシン-1, 19-ジイル基、6-メチル-11-ノナデシン-1, 19-ジイル基、6-エチル-12-ノナデシン-1, 19-ジイル基、7, 16-ジエチル-13-ノナデシン-1, 19-ジイル基、9-s-ブチル-14-ノナデシン-1, 19-ジイル基、8-メチル-15-ノナデシン-1, 19-ジイル基、10-エチル-16-ノナデシン-1, 19-ジイル基、10-i-プロピル-17-ノナデシン-1, 19-ジイル基、

8-メチル-2-イコシン-1, 20-ジイル基、6-エチル-3-イコシン-1, 20-ジイル基、10-i-プロピル-4-イコシン-1, 20-ジイル基、11-n-プロピル-5-イコシン-1, 20-ジイル基、12-メチル-6-イコシン-1, 20-ジイル基、11-エチル-7-イコシン-1, 20-ジイル基、13-n-プロピル-8-イコシン-1, 20-ジイル基、6-i-プロピル-9-イコシン-1, 20-ジイル基、5-n-プロピル-10-イコシン-1, 20-ジイル基、7-メチル-11-イコシン-1, 20-ジイル基、8-エチル-12-イコシン-1, 20-ジイル基、10-n-プロピル-13-イコシン-1, 20-ジイル基、9-i-プロピル-14-イコシン-1, 20-ジイル基、10-n-ブチル-15-イコシン-1, 20-ジイル基、8-s-ブチル-16-イコシン-1, 20-ジイル基、7-i-ブチル-17-イ

コシン-1, 20-ジイル基、9-メチル-18-イコシン-1, 20-ジイル基、

- 11-メチル-2-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、12-n-ブチル-3-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、10-n-ペンチル-4-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、8-エチル-5-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、10-i-  
5 プロピル-6-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、5-n-プロピル-7-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、13-n-ブチル-8-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、15-s-ブチル-9-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、5-メチル-10-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、15-エチル-6-メチル-1  
10 1-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、8-エチル-12-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、7-メチル-13-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、11-エチル-14-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、6-エチル-15-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、9-メチル-16-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、5-エチル-9-メチル-17-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、10, 10-  
15 ジメチル-18-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、9-エチル-19-ヘニコシン-1, 21-ジイル基、

- 11-メチル-2-ドコシン-1, 22-ジイル基、12-エチル-3-ドコシン-1, 22-ジイル基、13-i-プロピル-4-ドコシン-1, 22-ジイル基、10-n-プロピル-5-ドコシン-1, 22-ジイル基、10-n-ブ  
20 チル-6-ドコシン-1, 22-ジイル基、15-s-ブチル-7-ドコシン-1, 22-ジイル基、11-i-ブチル-8-ドコシン-1, 22-ジイル基、5, 15-ジメチル-9-ドコシン-1, 22-ジイル基、8, 14-ジエチル-10-ドコシン-1, 22-ジイル基、5-メチル-11-ドコシン-1, 22-ジイル基、7-エチル-12-ドコシン-1, 22-ジイル基、10-メチル-13-ドコシン-1, 22-ジイル基、10-エチル-14-ドコシン-1, 22-ジイル基、9-エチル-15-ドコシン-1, 22-ジイル基、8-メチル-16-ドコシン-1, 22-ジイル基、7-i-プロピル-17-ドコシン-1, 22-ジイル基、10-i-ブチル-18-ドコシン-1, 22-ジイル基、9, 10-ジメチル-19-ドコシン-1, 22-ジイル基、13-エチ

- ル-20-ドコシン-1, 22-ジイル基、  
19-メチル-2-トリコシン-1, 23-ジイル基、10, 15-ジメチル-  
3-トリコシン-1, 23-ジイル基、3, 11, 16-トリメチル-4-トリ  
コシン-1, 23-ジイル基、12-エチル-5-トリコシン-1, 23-ジ  
5 イル基、6, 13-ジエチル-6-トリコシン-1, 23-ジイル基、4, 12,  
18-トリエチル-7-トリコシン-1, 23-ジイル基、18-i-プロピル  
-8-トリコシン-1, 23-ジイル基、14-n-プロピル-9-トリコシン  
-1, 23-ジイル基、8-n-ブチル-10-トリコシン-1, 23-ジイル  
基、15-s-ブチル-11-トリコシン-1, 23-ジイル基、5-i-ブチ  
10 ル-12-トリコシン-1, 23-ジイル基、7-エチル-9-メチル-13-  
トリコシン-1, 23-ジイル基、9-メチル-14-トリコシン-1, 23-  
ジイル基、4, 18-ジメチル-15-トリコシン-1, 23-ジイル基、3,  
4, 11-トリメチル-16-トリコシン-1, 23-ジイル基、9-エチル-  
17-トリコシン-1, 23-ジイル基、10, 13-ジエチル-18-トリコ  
15 シン-1, 23-ジイル基、5, 8, 15-トリエチル-19-トリコシン-1  
, 23-ジイル基、15-i-プロピル-20-トリコシン-1, 23-ジイル  
基、17-n-プロピル-21-トリコシン-1, 23-ジイル基、  
16-n-ブチル-2-テトラコシン-1, 24-ジイル基、11-s-ブチル  
-3-テトラコシン-1, 24-ジイル基、8-i-ブチル-4-テトラコシン  
20 -1, 24-ジイル基、18-エチル-9-メチル-5-テトラコシン-1, 2  
4-ジイル基、13-メチル-6-テトラコシン-1, 24-ジイル基、4, 1  
9-ジメチル-7-テトラコシン-1, 24-ジイル基、5, 11, 17-トリ  
エチル-8-テトラコシン-1, 24-ジイル基、6-エチル-9-テトラコシ  
ン-1, 24-ジイル基、7, 16-ジエチル-10-テトラコシン-1, 24  
25 -ジイル基、5, 9, 18-トリエチル-11-テトラコシン-1, 24-ジイ  
ル基、10-n-プロピル-12-テトラコシン-1, 24-ジイル基、20-  
i-プロピル-13-テトラコシン-1, 24-ジイル基、9-n-ブチル-1  
4-テトラコシン-1, 24-ジイル基、11-s-ブチル-15-テトラコシ  
ン-1, 24-ジイル基、13-i-ブチル-16-テトラコシン-1, 24-

ジイル基、10-エチル-13-メチル-17-テトラコシン-1, 24-ジイル基、6-メチル-18-テトラコシン-1, 24-ジイル基、5, 7-ジメチル-19-テトラコシン-1, 24-ジイル基、4, 8, 13-トリメチル-20-テトラコシン-1, 24-ジイル基、18-エチル-21-テトラコシン-1, 24-ジイル基、6, 10-ジエチル-22-テトラコシン-1, 24-ジイル基、

9, 13, 16-トリメチル-2-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、12-n-プロピル-3-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、11-i-プロピル-4-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、20-n-ブチル-5-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、17-i-ブチル-6-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、15-s-ブチル-7-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、15-エチル-23-メチル-8-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、11-メチル-8-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、13, 17-ジメチル-9-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、5, 8, 21-トリメチル-10-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、17-エチル-11-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、8, 18-ジエチル-12-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、10, 15, 18-トリメチル-13-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、4-n-プロピル-14-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、20-i-プロピル-15-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、8-n-ブチル-16-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、11-s-ブチル-17-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、5, 22-ジメチル-18-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、5-i-ブチル-19-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、9-メチル-13-エチル-20-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、15-メチル-21-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、6, 13-ジメチル-22-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、4, 8, 12-トリメチル-23-ペンタコシン-1, 25-ジイル基、

13-エチル-2-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、5, 16-ジエチル-3-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、7, 11, 16-トリメチル-4-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、12-n-プロピル-5-ヘキサコシン-1

, 26-ジイル基、21-i-プロピル-6-ヘキサコシン-1, 26-ジイル  
基、6-n-ブチル-7-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、13-s-ブチ  
ル-8-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、19-i-ブチル-9-ヘキサコ  
シン-1, 26-ジイル基、13-エチル-18-メチル-10-ヘキサコシン  
5 -1, 26-ジイル基、10-メチル-11-ヘキサコシン-1, 26-ジイル  
基、10, 20-ジメチル-12-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、7, 9  
, 17-トリメチル-13-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、8-エチル-  
14-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、5, 22-ジエチル-15-ヘキサ  
コシン-1, 26-ジイル基、7, 10, 21-トリメチル-16-ヘキサコシ  
10 -1, 26-ジイル基、15-n-プロピル-17-ヘキサコシン-1, 26  
-ジイル基、13-i-プロピル-18-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、  
8-n-ブチル-19-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、11-s-ブチル  
-20-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、14-i-ブチル-21-ヘキサ  
コシン-1, 26-ジイル基、5-エチル-21-メチル-22-ヘキサコシン  
15 -1, 26-ジイル基、7-メチル-23-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基  
、8, 14-ジメチル-24-ヘキサコシン-1, 26-ジイル基、  
7, 16, 24-トリメチル-2-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、9-エ  
チル-3-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、7, 16-ジメチル-4-ヘプ  
タコシン-1, 27-ジイル基、9, 13, 21-トリメチル-5-ヘプタコシ  
20 -1, 27-ジイル基、13-n-プロピル-6-ヘプタコシン-1, 27-  
ジイル基、10-i-プロピル-7-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、16  
-n-プロピル-8-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、18-メチル-9-  
ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、9-i-プロピル-10-ヘプタコシン-  
1, 27-ジイル基、15-エチル-7-メチル-11-ヘプタコシン-1, 2  
25 7-ジイル基、25-メチル-12-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、8,  
21-ジメチル-13-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、5, 11, 23-  
トリメチル-14-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、9-エチル-15-ヘ  
プタコシン-1, 27-ジイル基、8, 20-ジメチル-16-ヘプタコシン-  
1, 27-ジイル基、4, 8, 19-トリメチル-17-ヘプタコシン-1, 2

- 7-ジイル基、7-n-プロピル-18-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、  
21-i-プロピル-19-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、14-n-プロ  
ピル-20-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、8-エチル-21-ヘプタ  
コシン-1, 27-ジイル基、11-i-プロピル-22-ヘプタコシン-1,  
5 27-ジイル基、5-エチル-13-メチル-23-ヘプタコシン-1, 27-  
ジイル基、16-メチル-24-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、7-エチ  
ル-25-ヘプタコシン-1, 27-ジイル基、  
14-エチル-2-オクタコシン-1, 28-ジイル基、20-メチル-3-オ  
クタコシン-1, 28-ジイル基、7, 22-ジメチル-4-オクタコシン-1  
10 , 28-ジイル基、19-エチル-5-オクタコシン-1, 28-ジイル基、1  
1-メチル-6-オクタコシン-1, 28-ジイル基、13, 16-ジメチル-  
7-オクタコシン-1, 28-ジイル基、13-エチル-8-オクタコシン-1  
, 28-ジイル基、6-メチル-9-オクタコシン-1, 28-ジイル基、9,  
16-ジメチル-10-オクタコシン-1, 28-ジイル基、7-エチル-11  
15 -オクタコシン-1, 28-ジイル基、16-メチル-12-オクタコシン-1  
, 28-ジイル基、6, 15-ジメチル-13-オクタコシン-1, 28-ジイ  
ル基、22-エチル-14-オクタコシン-1, 28-ジイル基、6-メチル-  
15-オクタコシン-1, 28-ジイル基、8, 11-ジメチル-16-オクタ  
コシン-1, 28-ジイル基、23-エチル-17-オクタコシン-1, 28-  
20 ジイル基、4-メチル-18-オクタコシン-1, 28-ジイル基、7, 14-  
ジメチル-19-オクタコシン-1, 28-ジイル基、13-エチル-20-オ  
クタコシン-1, 28-ジイル基、8-メチル-21-オクタコシン-1, 28-  
ジイル基、11, 17-ジメチル-22-オクタコシン-1, 28-ジイル基  
, 10-エチル-23-オクタコシン-1, 28-ジイル基、9-メチル-24  
25 -オクタコシン-1, 28-ジイル基、7, 19-ジメチル-25-オクタコシ  
ン-1, 28-ジイル基、12-エチル-26-オクタコシン-1, 28-ジイ  
ル基、  
15-メチル-2-ノナコシン-1, 29-ジイル基、14-メチル-3-ノナ  
コシン-1, 29-ジイル基、12-メチル-4-ノナコシン-1, 29-ジイ

ル基、13-メチル-5-ノナコシン-1, 29-ジイル基、11-メチル-6-  
ノナコシン-1, 29-ジイル基、10-メチル-7-ノナコシン-1, 29-  
ジイル基、25-メチル-8-ノナコシン-1, 29-ジイル基、24-メチ  
ル-9-ノナコシン-1, 29-ジイル基、23-メチル-10-ノナコシン-  
5 1, 29-ジイル基、22-メチル-11-ノナコシン-1, 29-ジイル基、  
21-メチル-12-ノナコシン-1, 29-ジイル基、20-メチル-13-  
ノナコシン-1, 29-ジイル基、19-メチル-14-ノナコシン-1, 29-  
ジイル基、18-メチル-15-ノナコシン-1, 29-ジイル基、27-メ  
チル-16-ノナコシン-1, 29-ジイル基、26-メチル-17-ノナコシ  
10 ン-1, 29-ジイル基、25-メチル-18-ノナコシン-1, 29-ジイル  
基、24-メチル-19-ノナコシン-1, 29-ジイル基、23-メチル-2  
0-ノナコシン-1, 29-ジイル基、20-メチル-21-ノナコシン-1,  
29-ジイル基、19-メチル-22-ノナコシン-1, 29-ジイル基、18-  
メチル-23-ノナコシン-1, 29-ジイル基、17-メチル-24-ノナ  
15 コシン-1, 29-ジイル基、16-メチル-25-ノナコシン-1, 29-ジ  
イル基、6-メチル-26-ノナコシン-1, 29-ジイル基、及び5-メチル  
-27-ノナコシン-1, 29-ジイル基等の分岐鎖状のアルキニレン基が挙げ  
られる。

代表的には、Gとしては、置換されていてもよい炭素数1~30の直鎖状のアル  
20 キレン基が好ましく、置換されていてもよい炭素数2~15の直鎖状のアルキ  
レン基がより好ましく、水酸基で置換されていてもよい炭素数2~13の直鎖状  
のアルキレン基が更に好ましく、中でも、エタン-1, 2-ジイル基、プロパン  
-1, 3-ジイル基、ブタン-1, 4-ジイル基、ペンタン-1, 5-ジイル基  
、ヘキサン-1, 6-ジイル基、ヘプタン-1, 7-ジイル基、オクタン-1,  
25 8-ジイル基、ノナン-1, 9-ジイル基、デカン-1, 10-ジイル基、ウン  
デカン-1, 11-ジイル基、ドデカン-1, 12-ジイル基、トリデカン-1  
、13-ジイル基、2-ヒドロキシプロパン-1, 3-ジイル基、3-ヒドロキ  
シーオクタン-1, 8-ジイル基、3-ヒドロキシノナン-1, 9-ジイル基、  
及び3-ヒドロキシデカン-1, 10-ジイル基等が特に好ましい。

Gとして挙げられる、置換されていてもよい炭素数1～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基、置換されていてもよい炭素数2～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基、及び置換されていてもよい炭素数2～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基は、その1位でAと結合し、かつ、その $\omega$ 位でEと結合しているか、あるいは、その1位でEと結合し、かつ、その $\omega$ 位でAと結合しているが、その1位でAと結合し、かつ、その $\omega$ 位でEと結合しているのが好ましい。

Eは、単結合又は $-O-$ を示すが、好ましくは、単結合を示す。

Jは、単結合、置換されていてもよい芳香族炭化水素基、又は置換されていてもよい複素環基を示すが、単結合及び芳香族炭化水素基が好ましく、さらに単結合であるのが好ましい。

Jにおける置換されていてもよい芳香族炭化水素基、及び置換されていてもよい複素環基における置換基としては、 $-(CH_2)_k-COOR^{7b}$ 、 $-(CH_2)_l-CONR^{8c}R^{9c}$ 、 $-NR^{8d}R^{9d}$ 、及び水酸基等が挙げられる。ここで、k及びlは、独立して、0又は1を示し、 $R^{7b}$ は、水素原子、又は炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を示し、 $R^{8c}$ 、 $R^{9c}$ 、 $R^{8d}$ 、及び $R^{9d}$ は、それぞれ独立して、水素原子、又は炭素数1～3の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を示す。また、この置換基は、Qが単結合以外である場合、存在しないのが好ましく、Qが単結合である場合、 $-(CH_2)_k-COOR^{7b}$ （ここで、k及び $R^{7b}$ は、前記と同義である）であるのが好ましい。なお、Jが置換されている場合、この置換基の数は、1個～4個であり、好ましくは1個である。

Jにおける置換されていてもよい芳香族炭化水素基における芳香族炭化水素基の定義は、Arにおける芳香族炭化水素基と同様であるが、好ましくは、p-フェニレン基、及びm-フェニレン基等が挙げられる。

Jにおける置換されていてもよい芳香族炭化水素基としては、無置換のp-フェニレン基、無置換のm-フェニレン基、及び $-COOH$ で置換されているフェニレン基等が好ましい。

Jにおける置換されていてもよい複素環基の複素環とは、同一又は異なって、酸素原子、窒素原子、硫黄原子などのヘテロ原子1個～4個を含む4員～10員



の、単環又は縮合環式の脂肪族環又は芳香族環を意味し、具体例としては、オキセタン、フラン、ジヒドロフラン、テトラヒドロフラン、ピラン、ジヒドロピラン、テトラヒドロピラン、ジオキサール、チオフエン、ジヒドロチオフエン、テトラヒドロチオフエン、チオピラン、ジヒドロチオピラン、テトラヒドロチオピラン、ピロール、ジヒドロピロール、ピロリジン、ピリジン、ジヒドロピリジン、5 テトラヒドロピリジン、ピペリジン、ピラゾール、2-ピラゾリン、ピラゾリジン、イミダゾール、イミダゾリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、オキサゾリン、ピペラジン、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-トリアゾール、テトラゾール、イソオキサゾール、1, 3-オキサゾール、1, 2, 3-オキサジアゾール、10 1, 2, 4-オキサジアゾール、1, 2, 5-オキサジアゾール、1, 3, 4-オキサジアゾール、1, 2-チアゾール、1, 3-チアゾール、1, 2, 3-チアジアゾール、1, 2, 4-チアジアゾール、1, 2, 5-チアジアゾール、1, 3, 4-チアジアゾール、1, 3-ジオキサラン、1, 4-ジオキサン、オキサゾリジン、モルホリン、インドール、キノリン、イソキノリン、ベンゾピラン、ベンゾフラン、ベンゾチオフエン、ベンゾジアゾール、ベン15 ゾオキサゾール、及びベンゾチアゾール等が挙げられるが、好ましくは、フラン、及びオキサゾール等が挙げられる。Jにおける複素環基は、これらの複素環中の、置換基を有する位置を除いた異なる2つの位置に、1個ずつ結合手を有する基を意味するが、好ましくは、フラン-2, 5-ジイル基、1, 3-オキサゾール-2, 4-ジイル基、及び1, 3-オキサゾール-2, 5-ジイル基等が挙げ20 られる。

Jにおける置換されていてもよい複素環基としては、無置換のフラン-2, 5-ジイル基、無置換の1, 3-オキサゾール-2, 4-ジイル基、及び無置換の1, 3-オキサゾール-2, 5-ジイル基等が好ましい。

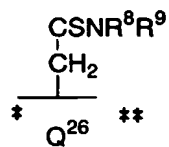
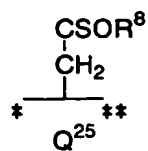
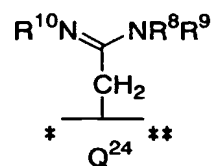
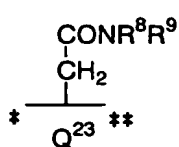
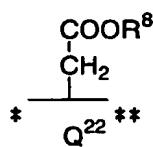
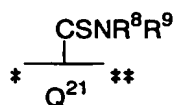
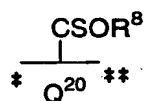
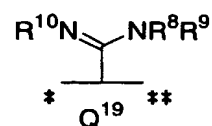
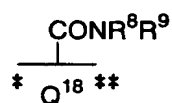
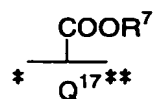
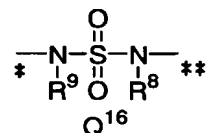
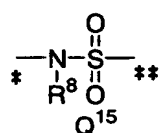
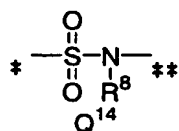
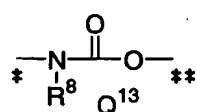
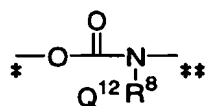
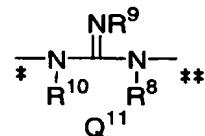
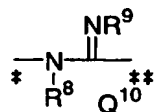
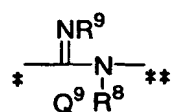
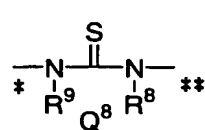
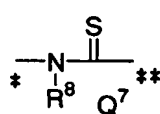
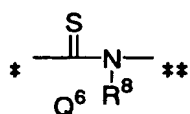
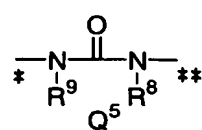
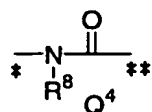
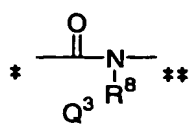
25 Jにおける置換されていてもよい芳香族炭化水素基、及び置換されていてもよい複素環基は、2個の結合手のいずれか一方でEと結合し、もう一方でYと結合していれば、どちらの一方でEと結合していてもよいが、好ましくは、1, 3-オキサゾール-2, 4-ジイル基においては、4位でEと結合し、1, 3-オキサゾール-2, 5-ジイル基においては、5位でEと結合している。

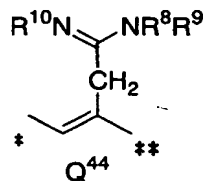
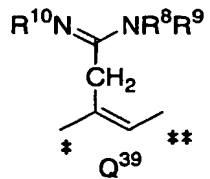
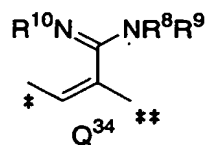
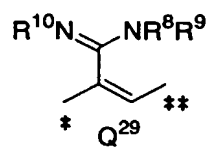
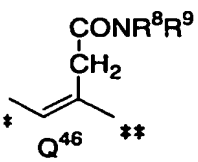
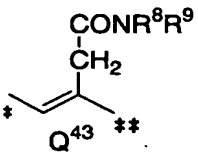
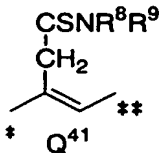
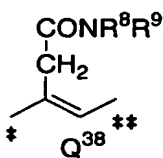
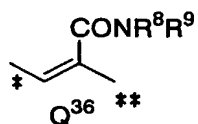
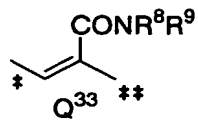
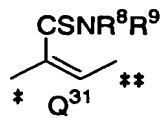
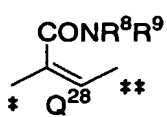
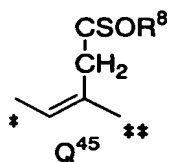
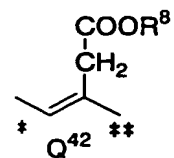
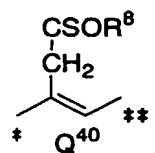
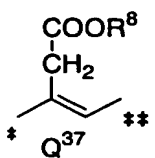
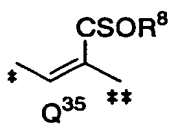
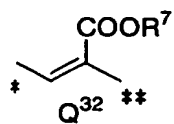
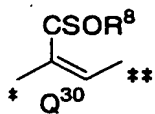
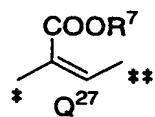
Yは、単結合又は－O－を示すが、好ましくは単結合を示す。

- Lは、単結合、炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基、炭素数2～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基、又は炭素数2～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基を示すが、単結合が好ましく、また、Jが
- 5 置換されていてもよい芳香族炭化水素基であり、かつYが単結合である場合は、Lは、単結合、及び炭素数1～5の直鎖状のアルキレン基が好ましく、中でも単結合、及び炭素数1～3の直鎖状のアルキレン基が好ましく、単結合及びプロパン－1，3－ジイル基が特に好ましく、Jが置換されていてもよい芳香族炭化水素基であり、かつYが－O－である場合は、Lは、炭素数1～5の直鎖状のアル
- 10 キレン基が好ましく、中でも炭素数2～4の直鎖状のアルキレン基が好ましい。

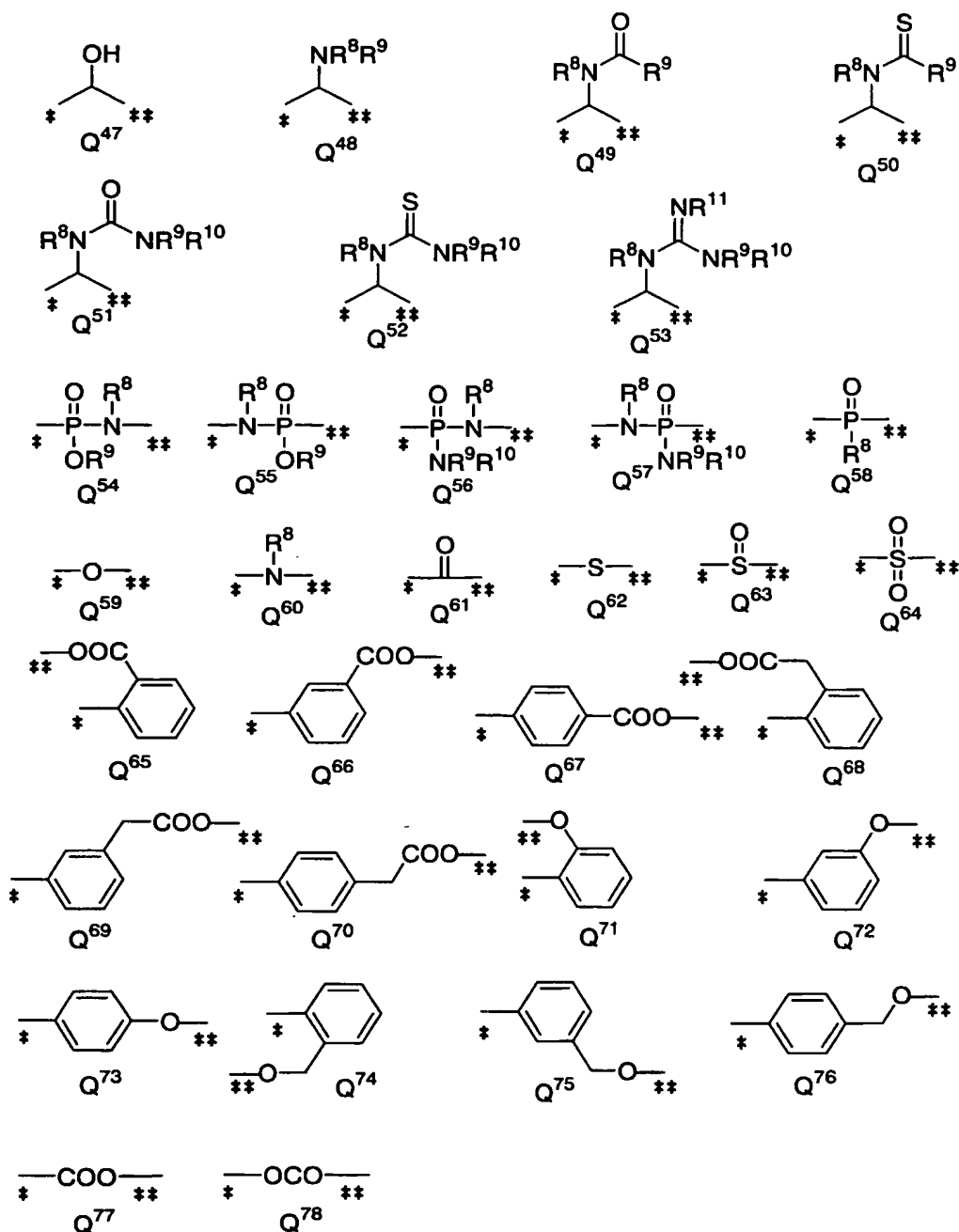
- Lにおける、炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基、炭素数2～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基、炭素数2～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基、炭素数1～5の直鎖状のアルキレン基、炭素数1～3の直鎖状のアルキレン基、及び炭素数2～4の直鎖状のアルキレン基の具
- 15 体例としては、Gにおける、置換されていてもよい炭素数1～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基、置換されていてもよい炭素数2～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基、及び置換されていてもよい炭素数2～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基の具体例として列挙したものの中から、該当するものを選択し、更にメチレン基を追加して列挙することができる。
- 20 また、2つの結合手の一方でYと結合し、もう一方でQと結合しているという条件を満たせば、どちらの結合手がYと結合していてもよい。

Qは、単結合、又は下記式：





、及び



- (ここで、 $\text{R}^7$ は、水素原子、又は炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示し、 $\text{R}^8$ 、 $\text{R}^9$ 、 $\text{R}^{10}$ 、及び $\text{R}^{11}$ は、それぞれ独立して、水素原子、又は炭素数1～3の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示す。)
- 5 から選択される1つの基を示すが、 $\text{Q}$ が、 $\text{Q}^2$  {ここで、 $\text{Q}^2$ としては、単結合、

- Q<sup>62</sup>、Q<sup>63</sup>、Q<sup>64</sup>、Q<sup>3</sup>（更にここで、R<sup>8</sup>は、前記と同義である。）、Q<sup>4</sup>（更にここで、R<sup>8</sup>は、前記と同義である。）、Q<sup>17</sup>（更にここで、R<sup>7</sup>は、前記と同義である。）、Q<sup>32</sup>（更にここで、R<sup>7</sup>は、前記と同義である。）、及びQ<sup>27</sup>（更にここで、R<sup>7</sup>は、前記と同義である。）が挙げられる。}であるのが好ましく、抗アンドロゲン活性の強さの点では、Qが、Q<sup>62</sup>、Q<sup>63</sup>、Q<sup>64</sup>、及びQ<sup>3</sup>であるもの、及びR<sup>8</sup>が水素原子であるQ<sup>4</sup>が更に好ましく、Q<sup>62</sup>、Q<sup>63</sup>、Q<sup>64</sup>、及びQ<sup>3</sup>が特に好ましい。また、QがQ<sup>3</sup>である場合、Q<sup>3</sup>の窒素原子とR<sup>8</sup>とZとが一緒になって複素環基を形成するのも好ましい。また、経口吸収性の点では、Qが、R<sup>7</sup>が水素原子であるQ<sup>17</sup>、R<sup>7</sup>が水素原子であるQ<sup>32</sup>、及びR<sup>7</sup>が水素原子であるQ<sup>27</sup>が更に好ましい。
- 10 また、Zが、-COOHである場合は、経口吸収性の点では、Qが、単結合であるのも好ましい。

Qにおいては、\*を付した位置でLと結合し、\*\*を付した位置でZと結合している。

- Zは、水素原子、置換されていてもよい炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基、炭素数3～6のシクロアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数2～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数2～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニル基、-O-R<sup>d</sup>（ここで、R<sup>d</sup>は、水素原子、又は水酸基の保護基を示す）、又は-COOHを示す。
- 15 Zにおける、置換されていてもよい炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基における置換基としては、ハロゲン原子、シクロアルキル基、直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基で置換されていてもよいフェニル基、複素環基、水酸基が挙げられる。ここで、前記の複素環基としては、たとえばフリル基などが挙げられる。前記のハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等が挙げられるが、好ましくはフッ素原子が挙げられる。前記の置換されていてもよい炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基の置換基がハロゲン原子である場合、置換されているハロゲン原子の数は、1個～10個であり、好ましくは、3個～9個、特に好ましくは5個である。その置換様式としては、ある1つの炭素原子上の全ての水素原子がハロゲン原子で置換されている
- 20
- 25

(例えば、トリハロメチル基、1, 1, 3, 3, 3-ペンタハロプロピル基等が挙げられる。)のが好ましい。

Zにおける、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数2~10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニル基、及びハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数2~10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニル基の、ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等が挙げられるが、好ましくはフッ素原子が挙げられる。置換されているハロゲン原子の数は、1個~10個であり、好ましくは、3個~9個、特に好ましくは5個である。その置換様式としては、ある1つの炭素原子上の全ての水素原子がハロゲン原子で置換されているのが好ましい。

Zにおける、置換されていてもよい炭素数1~10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基の、炭素数1~10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基、n-ヘプチル基、n-オクチル基、n-ノニル基、及びn-デシル基である直鎖状のアルキル基、並びに1-メチルエチル基、1-メチルプロピル基、2-メチルプロピル基、1-メチルブチル基、2-メチルブチル基、3-メチルブチル基、1, 1-ジメチルプロピル基、1, 2-ジメチルプロピル基、2, 2-ジメチルプロピル基、1-エチルプロピル基、1-メチルペンチル基、2-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、4-メチルペンチル基、1, 1-ジメチルブチル基、1, 2-ジメチルブチル基、1, 3-ジメチルブチル基、2, 2-ジメチルブチル基、2, 3-ジメチルブチル基、3, 3-ジメチルブチル基、1-エチルブチル基、2-エチルブチル基、1-メチルヘキシル基、2-メチルヘキシル基、3-メチルヘキシル基、4-メチルヘキシル基、5-メチルヘキシル基、1-エチルペンチル基、2-エチルペンチル基、3-エチルペンチル基、1, 1-ジメチルペンチル基、1, 2-ジメチルペンチル基、1, 3-ジメチルペンチル基、1, 4-ジメチルペンチル基、2, 2-ジメチルペンチル基、2, 3-ジメチルペンチル基、2, 4-ジメチルペンチル基、3, 3-ジメチルペンチル基、3, 4-ジメチルペンチル基、4, 4-ジメチルペンチル基、1-プロピルブチル基、

- 1-エチル-1-メチルブチル基、1-エチル-2-メチルブチル基、1-エチル-3-メチルブチル基、2-エチル-1-メチルブチル基、2-エチル-2-メチルブチル基、2-エチル-3-メチルブチル基、1, 1, 2-トリメチルブチル基、1, 1, 3-トリメチルブチル基、1, 2, 2-トリメチルブチル基、  
5 1, 2, 3-トリメチルブチル基、1, 3, 3-トリメチルブチル基、2, 2, 3-トリメチルブチル基、2, 3, 3-トリメチルブチル基、1-メチルヘプチル基、2-メチルヘプチル基、3-メチルヘプチル基、4-メチルヘプチル基、5-メチルヘプチル基、6-メチルヘプチル基、1-エチルヘキシル基、2-エチルヘキシル基、3-エチルヘキシル基、4-エチルヘキシル基、1, 1-ジメチルヘキシル基、1, 2-ジメチルヘキシル基、1, 3-ジメチルヘキシル基、  
10 1, 4-ジメチルヘキシル基、1, 5-ジメチルヘキシル基、2, 2-ジメチルヘキシル基、2, 3-ジメチルヘキシル基、2, 4-ジメチルヘキシル基、2, 5-ジメチルヘキシル基、3, 3-ジメチルヘキシル基、3, 4-ジメチルヘキシル基、3, 5-ジメチルヘキシル基、4, 4-ジメチルヘキシル基、4, 5-ジメチルヘキシル基、  
15 5, 5-ジメチルヘキシル基、  
1-プロピルペンチル基、2-プロピルペンチル基、1-エチル-1-メチルペンチル基、1-エチル-2-メチルペンチル基、1-エチル-3-メチルペンチル基、1-エチル-4-メチルペンチル基、2-エチル-1-メチルペンチル基、2-エチル-2-メチルペンチル基、2-エチル-3-メチルペンチル基、2-エチル-4-メチルペンチル基、3-エチル-1-メチルペンチル基、3-エチル-2-メチルペンチル基、3-エチル-3-メチルペンチル基、3-エチル-4-メチルペンチル基、1, 1, 2-トリメチルペンチル基、1, 1, 3-トリメチルペンチル基、1, 1, 4-トリメチルペンチル基、1, 2, 2-トリメチルペンチル基、1, 2, 3-トリメチルペンチル基、1, 2, 4-トリメチルペンチル基、1, 3, 3-トリメチルペンチル基、1, 3, 4-トリメチルペンチル基、1, 4, 4-トリメチルペンチル基、2, 2, 3-トリメチルペンチル基、2, 2, 4-トリメチルペンチル基、2, 3, 3-トリメチルペンチル基、2, 3, 4-トリメチルペンチル基、2, 4, 4-トリメチルペンチル基、3, 3, 4-トリメチルペンチル基、3, 4, 4-トリメチルペンチル基、1-メチ



ル-1-プロピルブチル基、2-メチル-1-プロピルブチル基、3-メチル-  
1-プロピルブチル基、1, 1-ジエチルブチル基、1, 2-ジエチルブチル基  
、2, 2-ジエチルブチル基、1, 2-ジメチル-1-エチルブチル基、1, 3  
-ジメチル-1-エチルブチル基、2, 2-ジメチル-1-エチルブチル基、2  
5 , 3-ジメチル-1-エチルブチル基、3, 3-ジメチル-1-エチルブチル基  
、1, 1-ジメチル-2-エチルブチル基、1, 2-ジメチル-2-エチルブチ  
ル基、1, 3-ジメチル-2-エチルブチル基、2, 3-ジメチル-2-エチル  
ブチル基、3, 3-ジメチル-2-エチルブチル基、1, 1-ジエチル-2-メ  
チルプロピル基、1-メチルオクチル基、2-メチルオクチル基、3-メチルオ  
10 クチル基、4-メチルオクチル基、5-メチルオクチル基、6-メチルオクチル  
基、7-メチルオクチル基、1-エチルヘプチル基、2-エチルヘプチル基、3  
-エチルヘプチル基、4-エチルヘプチル基、5-エチルヘプチル基、1, 1-  
ジメチルヘプチル基、1, 2-ジメチルヘプチル基、1, 3-ジメチルヘプチル  
基、1, 4-ジメチルヘプチル基、1, 5-ジメチルヘプチル基、1, 6-ジメ  
15 チルヘプチル基、2, 2-ジメチルヘプチル基、2, 3-ジメチルヘプチル基、  
2, 4-ジメチルヘプチル基、2, 5-ジメチルヘプチル基、2, 6-ジメチル  
ヘプチル基、3, 3-ジメチルヘプチル基、3, 4-ジメチルヘプチル基、3,  
5-ジメチルヘプチル基、3, 6-ジメチルヘプチル基、4, 4-ジメチルヘプ  
チル基、4, 5-ジメチルヘプチル基、4, 6-ジメチルヘプチル基、5, 5-  
20 ジメチルヘプチル基、5, 6-ジメチルヘプチル基、6, 6-ジメチルヘプチル  
基、

1-プロピルヘキシル基、2-プロピルヘキシル基、3-プロピルヘキシル基、  
1-エチル-1-メチルヘキシル基、1-エチル-2-メチルヘキシル基、1-  
エチル-3-メチルヘキシル基、1-エチル-4-メチルヘキシル基、1-エチ  
25 ル-5-メチルヘキシル基、2-エチル-1-メチルヘキシル基、2-エチル-  
2-メチルヘキシル基、2-エチル-3-メチルヘキシル基、2-エチル-4-  
メチルヘキシル基、2-エチル-5-メチルヘキシル基、3-エチル-1-メチ  
ルヘキシル基、3-エチル-2-メチルヘキシル基、3-エチル-3-メチルヘ  
キシル基、3-エチル-4-メチルヘキシル基、3-エチル-4-メチルヘキシ

ル基、3-エチル-5-メチルヘキシル基、4-エチル-1-メチルヘキシル基、4-エチル-2-メチルヘキシル基、4-エチル-3-メチルヘキシル基、4-エチル-4-メチルヘキシル基、4-エチル-5-メチルヘキシル基、1, 1, 2-トリメチルヘキシル基、1, 1, 3-トリメチルヘキシル基、1, 1, 4-トリメチルヘキシル基、1, 1, 5-トリメチルヘキシル基、1, 2, 2-トリメチルヘキシル基、1, 2, 3-トリメチルヘキシル基、1, 2, 4-トリメチルヘキシル基、1, 2, 5-トリメチルヘキシル基、1, 3, 3-トリメチルヘキシル基、1, 3, 4-トリメチルヘキシル基、1, 3, 5-トリメチルヘキシル基、1, 4, 4-トリメチルヘキシル基、1, 4, 5-トリメチルヘキシル基、1, 5, 5-トリメチルヘキシル基、2, 2, 3-トリメチルヘキシル基、2, 2, 4-トリメチルヘキシル基、2, 2, 5-トリメチルヘキシル基、2, 3, 3-トリメチルヘキシル基、2, 3, 4-トリメチルヘキシル基、2, 3, 5-トリメチルヘキシル基、2, 4, 4-トリメチルヘキシル基、2, 4, 5-トリメチルヘキシル基、2, 5, 5-トリメチルヘキシル基、3, 3, 4-トリメチルヘキシル基、3, 3, 5-トリメチルヘキシル基、3, 4, 4-トリメチルヘキシル基、3, 4, 5-トリメチルヘキシル基、3, 5, 5-トリメチルヘキシル基、4, 4, 5-トリメチルヘキシル基、4, 5, 5-トリメチルヘキシル基、1-メチル-ノニル基、2-メチル-ノニル基、3-メチル-ノニル基、4-メチル-ノニル基、5-メチル-ノニル基、6-メチル-ノニル基、7-メチル-ノニル基、8-メチル-ノニル基、及び9-メチル-ノニル基等の分岐鎖状のアルキル基が挙げられるが、炭素数1~10の直鎖状のアルキル基が好ましく、中でもメチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、n-ペンチル基が特に好ましい。

Zにおける、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数2~10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニル基の炭素数2~10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニル基としては、ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1, 3-ブタジエニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、2, 4-ペンタジエニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、2, 4-ヘキサジエニル基、2-ヘプテニ

ル基、3-ヘプテニル基、4-ヘプテニル基、5-ヘプテニル基、2, 4-ヘプ  
タジエニル基、2, 5-ヘプタジエニル基、3, 5-ヘプタジエニル基、2-オ  
クテニル基、3-オクテニル基、4-オクテニル基、5-オクテニル基、6-オ  
クテニル基、2, 4-オクタジエニル基、2, 5-オクタジエニル基、2, 6-  
5 オクタジエニル基、2, 4, 6-オクタトリエニル基、2-ノネニル基、3-ノ  
ネニル基、4-ノネニル基、5-ノネニル基、6-ノネニル基、7-ノネニル基  
、2-デセニル基、3-デセニル基、4-デセニル基、5-デセニル基、6-デ  
セニル基、7-デセニル基、8-デセニル基等の直鎖状のアルケニル基、  
並びに1-メチルエテニル基、2-メチル-1-プロペニル基、2-メチル-2  
10 -プロペニル基、2-メチル-1-ブテニル基、3-メチル-2-ブテニル基、  
2-メチル-3-ブテニル基、2, 3-ジメチル-1, 3-ブタジエニル基、3  
-エチル-2-プロペニル基、4-メチル-3-プロペニル基、3-メチル-2  
、4-プロパジエニル基、3, 4-ジエチル-2-ヘキセニル基、4-メチル-  
3-ヘキセニル基、2-メチル-4-ヘキセニル基、3, 5-ジメチル-2, 4  
15 -ヘキサジエニル基、5-エチル-3-メチル-2-ヘプテニル基、5-メチル  
-3-ヘプテニル基、4-n-プロピル-4-ヘプテニル基、3, 6-ジメチル  
-5-ヘプテニル基、5-エチル-2, 4-ヘプタジエニル基、2, 6-ジメチ  
ル-2, 5-ヘプタジエニル基、4-エチル-3, 5-ヘプタジエニル基、4,  
6-ジメチル-2-オクテニル基、5-エチル-3-オクテニル基、3-エチル  
20 -4-オクテニル基、3-エチル-5-オクテニル基、3, 4-ジメチル-6-  
オクテニル基、5-エチル-2, 4-オクタジエニル基、3-メチル-2, 5-  
オクタジエニル基、5-エチル-2, 6-オクタジエニル基、4-メチル-2,  
4, 6-オクタトリエニル基、5-メチル-2-ノネニル基、6-メチル-3-  
ノネニル基、7-メチル-4-ノネニル基、3-メチル-5-ノネニル基、4-  
25 メチル-6-ノネニル基、3-メチル-7-ノネニル基等の分岐鎖状のアルケニ  
ル基が挙げられる。

Zにおける、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数2~10の直鎖もし  
しくは分岐鎖状のアルキニル基の炭素数2~10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキ  
ニル基としては、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチ

ニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1, 3-ブタジイニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、2, 4-ペンタジイニル基、2-ヘキシニル基、3-ヘキシニル基、4-ヘキシニル基、2, 4-ヘキサジイニル基、2-ヘプチニル基、3-ヘプチニル基、4-ヘプチニル基、5-ヘプチニル基、2, 4-ヘプタジイニル基、2, 5-ヘプタジイニル基、3, 5-ヘプタジイニル基、2-オクチニル基、3-オクチニル基、4-オクチニル基、5-オクチニル基、6-オクチニル基、2, 4-オクタジイニル基、2, 5-オクタジイニル基、2, 6-オクタジイニル基、2, 4, 6-オクタトリイニル基、2-ノニニル基、3-ノニニル基、4-ノニニル基、5-ノニニル基、6-ノニニル基、7-ノニニル基、2-デシニル基、3-デシニル基、4-デシニル基、5-デシニル基、6-デシニル基、7-デシニル基、8-デシニル基等の直鎖状のアルキニル基、並びに、1-メチル-2-プロピニル基、3-メチル-1-ブチニル基、2-メチル-3-ブチニル基、4-メチル-2-ペンチニル基、2-メチル-3-ペンチニル基、4-エチル-2-ヘキシニル基、5-メチル-3-ヘキシニル基、2-メチル-4-ヘキシニル基、5-エチル-6-メチル-2-ヘプチニル基、5-メチル-3-ヘプチニル基、3-n-プロピル-4-ヘプチニル基、4, 4-ジメチル-5-ヘプチニル基、6-メチル-2, 4-ヘプタジイニル基、4-メチル-2, 5-ヘプタジイニル基、2-メチル-3, 5-ヘプタジイニル基、6, 6-ジメチル-2-オクチニル基、6-メチル-3-オクチニル基、3-エチル-4-オクチニル基、4-メチル-5-オクチニル基、4, 8-ジメチル-6-オクチニル基、7-メチル-2, 4-オクタジイニル基、4-メチル-2, 5-オクタジイニル基、5-エチル-2, 6-オクタジイニル基、5-メチル-2-ノニニル基、6-メチル-3-ノニニル基、7-メチル-4-ノニニル基、8-メチル-5-ノニニル基、4-メチル-6-ノニニル基、3-メチル-7-ノニニル基等の分岐鎖状のアルキニル基が挙げられる。

Zにおける、 $-O-R^d$ の $R^d$ としては、水素原子、及び水酸基の保護基が挙げられるが、好ましくは水素原子が挙げられる。水酸基の保護基としては、 $R^d$ における水酸基の保護基と同様のものが挙げられ、好ましいもの、特に好ましいものも、 $R^d$ におけるそれらと同様である。

代表的には、Zとしては、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基、及び水酸基、並びに、炭素数3～6のシクロアルキル基、水酸基、複素環基及び置換基を有していてもよいフェニル基からなる群より選ばれるいずれか1つの基で置換された炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基が好ましく、ハロゲン原子で置換されている炭素数3～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基が更に好ましく、中でもフッ素原子で置換されている炭素数3～8の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基が特に好ましく、4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル基であるのが更に特に好ましい。また、経口吸収性の点からは、Zとしては、-COOHであるのが好ましい。更に、経口吸収性の点からは、Qが、R<sup>7</sup>が水素原子であるQ<sup>17</sup>である場合は、Zが、水素原子であるのも好ましい。

なお、Qが、Q<sup>65</sup>、Q<sup>66</sup>、Q<sup>67</sup>、Q<sup>68</sup>、Q<sup>69</sup>、及びQ<sup>70</sup>である場合は、Zは、水素原子、及び置換されていない炭素数1～3の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基が好ましく、中でも、水素原子であるのが特に好ましい。また、Qが、Q<sup>71</sup>、Q<sup>72</sup>、Q<sup>73</sup>、Q<sup>74</sup>、Q<sup>75</sup>、及びQ<sup>76</sup>である場合は、Zは、水素原子であるのが好ましい。

Zが、-O-R<sup>d</sup>（ここで、R<sup>d</sup>は、前記と同義である。）、及び-COOHである、一般式（I）で表される化合物は、一般式（I）で表される化合物のうち、Zが、-O-R<sup>d</sup>（ここで、R<sup>d</sup>は、前記と同義である。）でも-COOHでもない化合物の中間体としても有用である。

また、QがQ<sup>3</sup>である場合、Q<sup>3</sup>の窒素原子とR<sup>8</sup>とZとが一緒になって形成する複素環基としては、たとえば、モルホリノ基、ピロリジニル基、ピペリジノ基などが挙げられる。

一般式（1）において、4（5）位の破線が実線と共に単結合を示し、X<sup>2</sup>が、-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-CO-NR<sup>8</sup>Z<sup>1</sup>（pは1以上の整数を示し、R<sup>8</sup>は水素原子、又は炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示し、Z<sup>1</sup>は水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を示す。）、-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-SO<sub>2</sub>-Z<sup>1</sup>（p、Z<sup>1</sup>は前記と同じ意味を示す。）、-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-SO-Z<sup>1</sup>（p、Z<sup>1</sup>は前記と同じ意味を示す。）、-Ph-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-CO-NR<sup>8</sup>Z<sup>1</sup>（Phはフェニレン基

を示し、 $p$ 、 $R^8$ 、 $Z^1$ は前記と同じ意味を示す。)、 $-Ph-O-(CH_2)_p-H$  ( $p$ は前記と同じ意味を示す。) からなる群より選ばれるいずれか1つの基を示すのが好ましく、さらに、

$p$ が1~13の整数であるのが好ましく；

- 5  $-(CH_2)_p-CO-NR^8Z^1$ における $-NR^8Z^1$ で示される基としては、  
 $p$ が5である場合、アミノ基、 $n$ -ペンチルアミノ基が好ましく；  
 $p$ が6である場合、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基が好ましく；  
 $p$ が7である場合、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、 $n$ -ブチルアミノ基、  
 $i$ -プロピルアミノ基、シクロヘキシルアミノ基、 $N$ - $n$ -ブチル- $N$ -メチル  
10 アミノ基、ジエチルアミノ基、メチルアミノ基、 $N$ -エチル- $N$ -メチルアミノ  
基、 $N$ -メチル- $N$ - $n$ -プロピルアミノ基、 $N$ -メチル- $N$ - $i$ -プロピルア  
ミノ基、 $N$ - $t$ -ブチル- $N$ -メチルアミノ基、 $n$ -プロピルアミノ基、 $n$ -ヘ  
キシルアミノ基、 $i$ -ペンチルアミノ基、 $i$ -ブチルアミノ基、2, 2-ジメチ  
ルプロピルアミノ基、1-エチルプロピルアミノ基、 $\gamma$ - $n$ -ヘキシルアミノ基  
15 、アミノ基、 $n$ -ペンチルアミノ基が好ましく、さらにジメチルアミノ基、エチ  
ルアミノ基、 $i$ -プロピルアミノ基、 $N$ - $n$ -ブチル- $N$ -メチルアミノ基、ジ  
エチルアミノ基、メチルアミノ基、 $N$ -エチル- $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -メチ  
ル- $N$ - $n$ -プロピルアミノ基、 $N$ -メチル- $N$ - $i$ -プロピルアミノ基、 $n$ -  
プロピルアミノ基が好ましく、特にジメチルアミノ基、エチルアミノ基、 $N$ - $n$ -  
20 ブチル- $N$ -メチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルアミノ基、 $N$ -エチ  
ル- $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -メチル- $N$ - $i$ -プロピルアミノ基が好ましく；  
 $p$ が8である場合、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、 $N$ - $n$ -ブチル- $N$ -  
メチルアミノ基が好ましく；  
 $p$ が9である場合、アミノ基、 $n$ -ペンチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエ  
25 チルアミノ基、 $N$ -エチル- $N$ -メチルアミノ基、 $N$ - $n$ -ブチル- $N$ -メチル  
アミノ基、 $N$ -メチル- $N$ - $n$ -プロピルアミノ基が好ましく、さらにジメチル  
アミノ基、ジエチルアミノ基、 $N$ - $n$ -ブチル- $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -メチ  
ル- $N$ - $n$ -プロピルアミノ基が好ましく、特にジメチルアミノ基、 $N$ -メチル  
- $N$ - $n$ -プロピルアミノ基が好ましく；

pが10である場合、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-n-ブチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-n-プロピルアミノ基が好ましく、さらにジメチルアミノ基が好ましく；

pが11である場合、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、N-n-ブチル-N-メチルアミノ基、アミノ基、n-ペンチルアミノ基が好ましく；

pが13である場合、アミノ基、n-ペンチルアミノ基が好ましく；

—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—SO<sub>2</sub>—Z<sup>1</sup>におけるpとしては5から13の整数が好ましく；

—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—SO<sub>2</sub>—Z<sup>1</sup>における—Z<sup>1</sup>で示される基としては、4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル基が好ましく；

10 —(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—SO—Z<sup>1</sup>におけるpとしては、7から13の整数が好ましく；

—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—SO—Z<sup>1</sup>における—Z<sup>1</sup>で示される基としては、4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル基が好ましく；

—Ph—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CO—NR<sup>8</sup>Z<sup>1</sup>におけるpとしては1～7の整数が好ましく；

15 —Ph—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CO—NR<sup>8</sup>Z<sup>1</sup>における—NR<sup>8</sup>Z<sup>1</sup>で示される基としては、アミノ基、n-ペンチルアミノ基が好ましく；さらに

pが1である場合、アミノ基が好ましく；

pが3である場合、アミノ基、n-ペンチルアミノ基が好ましく；

pが7である場合、アミノ基、n-ペンチルアミノ基が好ましく；

20 —Ph—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—Hにおけるpとしては、1が好ましい。

また、一般式(1)において、4(5)位の破線が実線と共に単結合又は二重結合を示し、X<sup>2</sup>が、—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—COOH(pは1以上の整数を示す。)、—

(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—OH(pは前記と同じ意味を示す。)、—Ph—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—COOH(Phはフェニレン基を示し、pは前記と同じ意味を示す。)、—

25 CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CO—NR<sup>8</sup>Z<sup>2</sup>(pは前記と同じ意味を示し、R<sup>8</sup>は水素原子、又は炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示し、Z<sup>2</sup>はシクロアルキル基、水酸基、カルボキシル基、複素環基、及びフェニル基からなる群より選ばれるいずれか1つの基で置換された炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を示すか、又は、—NR<sup>8</sup>Z<sup>2</sup>は、NとR<sup>8</sup>とZ<sup>2</sup>とが一緒になって複

- 素環を形成してもよい。) 、  $-(CH_2)_p-Ph-O-(CH_2)_q-CO-NR^8Z^3$  ( $Ph$ 、 $p$ 、 $R^8$ は前記と同じ意味を示し、 $q$ は1以上の整数を示し、 $Z^3$ は水素原子、又は、シクロアルキル基、水酸基、カルボキシ基、複素環基、及びフェニル基からなる群より選ばれるいずれか1つの基で置換されていてもよい
- 5 炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を示すか、又は、 $-NR^8Z^3$ は、 $N$ と $R^8$ と $Z^3$ とが一緒になって複素環を形成してもよい。) 、  $-(CH_2)_p-CH(COOH)-(CH_2)_3-CF_2-CF_3$  ( $p$ は前記と同じ意味を示す。) からなる群より選ばれるいずれか1つの基を示すのが好ましく、さらに、 $p$ が1～13の整数であるのが好ましく；
- 10  $-(CH_2)_p-COOH$ における $p$ としては、5～13の整数が好ましく；  
 $-(CH_2)_p-OH$ における $p$ としては、7～9の整数が好ましく；  
 $-Ph-O-(CH_2)_p-COOH$ における $p$ としては1～7の整数が好ましく；  
 $-(CH_2)_p-CO-NR^8Z^3$ における $p$ としては6～11の整数が好ましく
- 15 ；  
 $-(CH_2)_p-CO-NR^8Z^3$ における $-NR^8Z^3$ で示される基としては、シクロヘキシルメチルアミノ基、シクロプロピルメチルアミノ基、3-ヒドロキシプロピルアミノ基、 $t$ -ブチルベンジルアミノ基、2,2-ジフェニルエチルアミノ基、 $N$ -メチル- $N$ -ベンジルアミノ基、フェニルアミノ基、ベンジルアミノ基、2-フェニルエチルアミノ基、ピペリジノ基、ピロリジニル基、モルホリノ基が好ましく、さらに $N$ -メチル- $N$ -ベンジルアミノ基、ベンジルアミノ基、2-フェニルエチルアミノ基、ピペリジノ基、ピロリジニル基、モルホリノ基が好ましく、特にピペリジノ基、ピロリジニル基、モルホリノ基が好ましく；
- 20  $-(CH_2)_p-Ph-O-(CH_2)_q-CO-NR^8Z^3$ における $p$ としては3が好ましく；
- 25  $-(CH_2)_p-Ph-O-(CH_2)_q-CO-NR^8Z^3$ における $q$ としては3及び4が好ましく；  
 $-(CH_2)_p-Ph-O-(CH_2)_q-CO-NR^8Z^3$ における $-NR^8Z^3$ で示される基としては、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ピロリジニル基が



好ましく；

—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CH(COOH)—(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>—CF<sub>2</sub>—CF<sub>3</sub>におけるpとしては8が好ましく；

5 —(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—Ph—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>—COOHにおけるpとしては3が好ましく；

—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—Ph—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>—COOHにおけるqとしては3及び4が好ましい。

また、一般式(1)において、4(5)位の破線が実線と共に単結合又は二重結合を示し、X<sup>1</sup>が、—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—COOH(pは1以上の整数を示す。)、—

10 (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CH(COOH)—(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>—CF<sub>2</sub>—CF<sub>3</sub>(pは前記と同じ意味を示す。)、—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CH(COOMe)—(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>—CF<sub>2</sub>—CF<sub>3</sub>(pは前記と同じ意味を示す。)、—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—COOH(pは前記と同じ意味を示す。)、—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CH(COOH)—(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>—CF<sub>2</sub>—CF<sub>3</sub>(pは前記と同じ意味を示す。)、—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—S—(CH<sub>2</sub>

15 )<sub>3</sub>—CF<sub>2</sub>—CF<sub>3</sub>(pは前記と同じ意味を示す。)、—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—SO—(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>—CF<sub>2</sub>—CF<sub>3</sub>(pは前記と同じ意味を示す。)、—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—SO—(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>—CF<sub>2</sub>—CF<sub>3</sub>(pは前記と同じ意味を示す。)、—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—SO<sub>2</sub>—(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>—CF<sub>2</sub>—CF<sub>3</sub>(pは前記と同じ意味を示す。)

)、—Ph—O—CH<sub>3</sub>(Phはフェニレン基を示す。)、—Ph—O—(CH<sub>2</sub>

20 )<sub>p</sub>—COOH(Ph、pは前記と同じ意味を示す。)、—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CO—NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup>(pは前記と同じ意味を示し、R<sup>8</sup>は水素原子、又は炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示し、Z<sup>3</sup>は水素原子、又は、シクロアルキル基、水酸基、カルボキシ基、複素環基、及びフェニル基からなる群より

選ばれるいずれか1つの基で置換されていてもよい炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を示すか、又は、—NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup>は、NとR<sup>8</sup>とZ<sup>3</sup>とが一緒になって複素環を形成してもよい。)

25 —Ph—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CO—NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup>(Ph、p、R<sup>8</sup>、Z<sup>3</sup>、—NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup>は前記と同じ意味を示す。)、—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CO—NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup>(p、R<sup>8</sup>、Z<sup>3</sup>、—NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup>は前記と同じ意味を示す。)からなる群より選ばれるいずれか1つの基を示すのが好ましく、さら

に、

p が 3 ~ 13 の整数であるのが好ましく；

- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-COOH における p としては、7 ~ 11 の整数が好ましく；

5 - (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-CH(COOH)-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CF<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub> における p としては、8 が好ましく；

- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-CH(COOMe)-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CF<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub> における p としては、8 が好ましく；

-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-COOH における p としては、5 ~ 13 の整数が好ましく；

10 -O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-CH(COOH)-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CF<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub> における p としては 8 が好ましく；

- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CF<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub> における p としては 10 が好ましく；

15 - (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-SO-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CF<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub> における p としては 10 が好ましく；

-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-SO-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CF<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub> における p としては 5 ~ 13 の整数が好ましく；

-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-SO<sub>2</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CF<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub> における p としては 7 ~ 13 の整数が好ましく；

20 -Ph-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-COOH における p としては 3 ~ 7 の整数が好ましく；

- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-CO-NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup> における p としては 7 ~ 11 の整数が好ましく；

25 - (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-CO-NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup> における -NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup> で示される基としては、アミノ基、n-ペンチルアミノ基、ジメチルアミノ基、メチルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-n-プロピルアミノ基、ジエチルアミノ基、ベンジルアミノ基、N-n-ブチル-N-メチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、モルホリノ基、ピペリジノ基が好ましく；

-Ph-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-CO-NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup> における p としては 7 が好ましく；

—Ph—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CO—NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup>における—NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup>で示される基としてはアミノ基、n—ペンチルアミノ基が好ましく；

—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CO—NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup>におけるpとしては5～13の整数が好ましく；

- 5 —O—(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>—CO—NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup>における—NR<sup>8</sup>Z<sup>3</sup>で示される基としてはアミノ基、n—ペンチルアミノ基が好ましい。

X<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>としては、具体的には、水素原子、10—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチルスルフィニル) デシル基、11—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ウンデシル基、12—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ドデシル基、10—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチルスルホニル) デシル基、11—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチルスルホニル) ウンデシル基、12—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチルスルホニル) ドデシル基、10—{N—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} デシル基、11—{N—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} ウンデシル基、9—{N—(5, 5, 6, 6, 6—ペンタフルオロヘキサノイル) アミノ} ノニル基、10—{N—(5, 5, 6, 6, 6—ペンタフルオロヘキサノイル) アミノ} デシル基、9—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ノニルオキシ基、10—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチルスルフィニル) デシルオキシ基、11—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ウンデシルオキシ基、9—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチルスルホニル) ノニルオキシ基、10—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチルスルホニル) デシルオキシ基、11—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチルスルホニル) ウンデシルオキシ基、

9—{N—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} ノニルオキシ基、10—{N—(4, 4, 5, 5, 5—ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} デシルオキシ基、8—{N—(5, 5, 6, 6, 6—ペンタフルオロヘキサノイル) アミノ} オクチルオキシ基、9—{N—(5, 5,

- 6, 6, 6-ペンタフルオロヘキサノイル) アミノ} ノニルオキシ基、4- {8- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) オクチルオキシ} フェニル基、4- {9- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ノニルオキシ} フェニル基、4- {8- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) オクチルオキシ} フェニル基、4- {9- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ノニルオキシ} フェニル基、4- [8- {N- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} オクチルオキシ] フェニル基、4- [9- {N- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} ノニルオキシ] フェニル基、4- [7- {N- (5, 5, 6, 6, 6-ペンタフルオロヘキサノイル) アミノ} ヘプチルオキシ] フェニル基、4- [8- {N- (5, 5, 6, 6, 6-ペンタフルオロヘキサノイル) アミノ} オクチルオキシ] フェニル基、6- [4- {N- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} フェニル] ヘキシル基、5- [4- {N- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} フェニル] ペンチルオキシ基、トリデシルオキシ基、11-カルボキシ-15, 15, 16, 16, 16-ペンタフルオロヘキサデシル) 基、4- { {2-ヒドロキシ-3- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニルエチルオキシ) プロピル} オキシ} フェニル基、4-ヒドロキシ-9- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ノニル基、10-カルボキシ-14, 14, 15, 15, 15-ペンタフルオロペンタデシルオキシ基、9-カルボキシ-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデシルオキシ基、6-カルボキシ-10, 10, 11, 11, 11-ペンタフルオロウンデシル基、10-カルボキシ-14, 14, 15, 15, 15-ペンタフルオロペンタデシル基、14-カルボキシ-18, 18, 19, 19, 19-ペンタフルオロノナデシル基、9-カルボキシノニルオキシ基、6-カルボキシヘキシル基、10-カルボキシデシル基、14-カルボキシテトラデシル基、3- {4- (4-カルボキシブチル) フェニル} プロピル基、3- {4- (4-カルボキシ-8, 8, 9, 9, 9-ペンタフルオロノニル) フェニル} プロピル基、5- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル

スルフィニル) ペンチル基、9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル  
スルフィニル) ノニル基、13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペン  
チルスルフィニル) トリデシル基、4-ヒドロキシ-10-(4, 4, 5, 5,  
5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) デシル基、4-ヒドロキシ-15,  
5 15, 16, 16, 16-ペンタフルオロヘキサデシル基、9-{N-(4,  
4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} ノニル基、及び  
8-{N-(5, 5, 6, 6, 6-ペンタフルオロヘキサノイル) アミノ} オク  
チル基、

5-カルボキシペンチル基、7-カルボキシヘプチル基、9-カルボキシノニル  
10 基、11-カルボキシウンデシル基、13-カルボキシトリデシル基、9-カル  
ボキシ-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデシル基、9-  
メトキシカルボニル-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデ  
シル基、5-カルボキシペンチルオキシ基、7-カルボキシヘプチルオキシ基、  
10-カルボキシデシルオキシ基、11-カルボキシウンデシルオキシ基、13  
15 -カルボキシトリデシルオキシ基、23-カルボキシトリコサニルオキシ基、  
7-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-エチルアミ  
ノカルボニル) ヘプチル基、7-{N-(シクロプロピルメチル) アミノカルボ  
ニル} ヘプチル基、7-{N-(シクロヘキシルメチル) アミノカルボニル} ヘ  
プチル基、7-(N-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-イソプ  
20 ロピルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-t-ブチルアミノカルボニル  
) ヘプチル基、7-(N-シクロヘキシルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-  
{N-(3-ヒドロキシプロピル) アミノカルボニル} ヘプチル基、7-(N-  
メチル-N-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N, N-ジエチルア  
ミノカルボニル) ヘプチル基、7-(ピペリジノカルボニル) ヘプチル基、7-  
25 {N-(4-t-ブチルベンジル) アミノカルボニル} ヘプチル基、7-{N-  
(2, 2-ジフェニルエチル) アミノカルボニル} ヘプチル基、7-{N-(2-  
フリルメチル) アミノカルボニル} ヘプチル基、7-(N-メチルアミノカル  
ボニル) ヘプチル基、7-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル) ヘプチ  
ル基、7-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(

- N-メチル-N-イソプロピルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-メチル-N-ベンジルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(1-ピロリジニルカルボニル) ヘプチル基、7-(モルホリノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-メチル-N-tert-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-シクロプロピルアミノカルボニル) ヘプチル基、6-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) ヘキシル基、6-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) ヘキシル基、6-(ピペリジノカルボニル) ヘキシル基、8-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) オクチル基、8-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) オクチル基、8-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル) オクチル基、8-(N-ベンジルアミノカルボニル) オクチル基、8-{N-(2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル} オクチル基、8-(ピペリジノカルボニル) オクチル基、9-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) ノニル基、9-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) ノニル基、9-(1-ピロリジニルカルボニル) ノニル基、9-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル) ノニル基、9-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル) ノニル基、9-(N-ベンジルアミノカルボニル) ノニル基、9-(ピペリジノカルボニル) ノニル基、9-{N-(2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル} ノニル基、9-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル) ノニル基、9-(モルホリノカルボニル) ノニル基、10-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) デシル基、10-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) デシル基、10-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル) デシル基、10-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル) デシル基、10-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル) デシル基、10-(モルホリノカルボニル) デシル基、11-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) ウンデシル基、11-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) ウンデシル基、11-(ピペリジノカルボニル) ウンデシル基、11-(N-ベンジルアミノカルボニル) ウンデシル基、11-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル) ウンデシル基、11-{N-(2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル} ウンデシル基、7-{N-(2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル} ヘプチル基、7-(N-プロピルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-ヘキシルアミノカルボニル) ヘプチル

- ル基、7-(N-イソペンチルアミノカルボニル)ヘプチル基、7-(N-イソ  
ブチルアミノカルボニル)ヘプチル基、7-(N-ネオペンチルアミノカルボニ  
ル)ヘプチル基、7-{N-(3-ペンチル)アミノカルボニル}ヘプチル基、  
7-(N,N-ジヘキシルアミノカルボニル)ヘプチル基、7-(N-フェニル  
5 アミノカルボニル)ヘプチル基、7-(N-ベンジルアミノカルボニル)ヘプ  
チル基、7-{N-(2-フェニルエチル)アミノカルボニル}ヘプチル基、  
5-(アミノカルボニル)ペンチル基、5-(N-ペンチルアミノカルボニル)  
ペンチル基、7-(アミノカルボニル)ヘプチル基、7-(N-ペンチルアミ  
ノカルボニル)ヘプチル基、9-(アミノカルボニル)ノニル基、9-(N-ペン  
10 チルアミノカルボニル)ノニル基、11-(アミノカルボニル)ウンデシル基、  
11-(N-ペンチルアミノカルボニル)ウンデシル基、13-(アミノカルボ  
ニル)トリデシル基、13-(N-ペンチルアミノカルボニル)トリデシル基、  
8-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル)オクチル基、8-(N-メチ  
ル-N-プロピルアミノカルボニル)オクチル基、8-(モルホリノカルボニ  
15 )オクチル基、8-(N-メチルアミノカルボニル)オクチル基、10-(4,  
4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルファニル)デシル基、  
7-ヒドロキシヘプチル基、8-ヒドロキシオクチル基、9-ヒドロキシノ  
ニル基、  
7-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ヘプチル基  
20 、  
7-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)ヘプチル基、  
9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)ノニル基、1  
3-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)トリデシル基  
、  
25 4-(カルボキシメトキシ)フェニル基、4-(3-カルボキシプロポキシ)フ  
ェニル基、4-(7-カルボキシヘプチルオキシ)フェニル基、  
4-(カルバモイルメトキシ)フェニル基、4-(3-カルバモイルプロポキシ  
)フェニル基、4-(7-カルバモイルヘプチルオキシ)フェニル基、  
4-(3-N-ペンチルカルバモイルプロポキシ)フェニル基、4-(7-N-

- ペンチルカルバモイルヘプチルオキシ) フェニル基、  
4-メトキシフェニル基、  
5- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ペンチルオ  
キシ基、7- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ヘ  
5 プチルオキシ基、13- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフ  
イニル) トリデシルオキシ基、  
7- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ヘプチルオキ  
シ基、13- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) トリ  
デシルオキシ基、  
10 4- {5- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ペン  
チルオキシ} フェニル基、4- {7- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペ  
ンチルスルフィニル) ヘプチルオキシ} フェニル基、4- {5- (4, 4, 5,  
5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ペンチルオキシ} フェニル基、4  
- {7- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ヘプチル  
15 オキシ} フェニル基、  
3- {3- (3-カルボキシプロポキシ) フェニル} プロピル基、3- {3- (4-  
カルボキシブトキシ) フェニル} プロピル基、  
3- [3- {3- (N-メチルアミノカルボニル) プロポキシ} フェニル] プロ  
ピル基、3- [3- {3- (N, N-ジメチルアミノカルボニル) プロポキシ}  
20 フェニル] プロピル基、3- [3- {3- (1-ピロリジニルカルボニル) プロ  
ポキシ} フェニル] プロピル基、3- [3- {4- (N-メチルアミノカルボニ  
ル) ブトキシ} フェニル] プロピル基、3- [3- {4- (N, N-ジメチルア  
ミノカルボニル) ブトキシ} フェニル] プロピル基、3- [3- {4- (1-ピ  
ロリジニルカルボニル) ブトキシ} フェニル] プロピル基、  
25 5- (アミノカルボニル) ペンチルオキシ基、5- (N-ペンチルアミノカルボ  
ニル) ペンチルオキシ基、7- (アミノカルボニル) ヘプチルオキシ基、7- (N-  
ペンチルアミノカルボニル) ヘプチルオキシ基、9- (アミノカルボニル)  
ノニルオキシ基、9- (N-ペンチルアミノカルボニル) ノニルオキシ基、11  
- (アミノカルボニル) ウンデシルオキシ基、11- (N-ペンチルアミノカル



- ボニル) ウンデシルオキシ基、13-(アミノカルボニル) トリデシルオキシ基、及び、13-(N-ペンチルアミノカルボニル) トリデシルオキシ基が好ましく、さらに10-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) デシル基、11-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ウンデシル基、11-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ウンデシル基、9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ノニルオキシ基、11-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ウンデシルオキシ基、9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ノニルオキシ基、11-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ウンデシルオキシ基、9-カルボキシ-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデシルオキシ基、9-カルボキシノニルオキシ基、5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ペンチル基、9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ノニル基、
- 15 5-カルボキシペンチル基、7-カルボキシヘプチル基、9-カルボキシノニル基、11-カルボキシウンデシル基、13-カルボキシトリデシル基、9-カルボキシ-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデシル基、9-メトキシカルボニル-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデシル基、5-カルボキシペンチルオキシ基、7-カルボキシヘプチルオキシ基、
- 20 10-カルボキシデシルオキシ基、11-カルボキシウンデシルオキシ基、13-カルボキシトリデシルオキシ基、23-カルボキシトリコサニルオキシ基、7-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-エチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-{N-(シクロプロピルメチル) アミノカルボニル} ヘプチル基、7-{N-(シクロヘキシルメチル) アミノカルボニル} ヘプチル基、7-(N-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-イソプロピルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-t-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-シクロヘキシルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-{N-(3-ヒドロキシプロピル) アミノカルボニル} ヘプチル基、7-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N, N-ジエチルア
- 25

- ミノカルボニル) ヘプチル基、7-(ピペリジノカルボニル) ヘプチル基、7-  
{N-(4-*t*-ブチルベンジル) アミノカルボニル} ヘプチル基、7-{N-  
(2, 2-ジフェニルエチル) アミノカルボニル} ヘプチル基、7-{N-(2-  
フリルメチル) アミノカルボニル} ヘプチル基、7-(N-メチルアミノカル  
5 ボニル) ヘプチル基、7-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル) ヘプチ  
ル基、7-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(  
N-メチル-N-イソプロピルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-メチ  
ル-N-ベンジルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(1-ピロリジニルカル  
10 ボニル) ヘプチル基、7-(モルホリノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-メ  
チル-N-*t*-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7-(N-シクロプロピ  
ルアミノカルボニル) ヘプチル基、6-(N, N-ジメチルアミノカルボニル)  
ヘキシル基、6-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) ヘキシル基、6-(ピ  
ペリジノカルボニル) ヘキシル基、8-(N, N-ジメチルアミノカルボニル)  
オクチル基、8-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) オクチル基、8-(N-  
15 -メチル-N-ブチルアミノカルボニル) オクチル基、8-(N-ベンジルアミ  
ノカルボニル) オクチル基、8-{N-(2-ヒドロキシエチル) アミノカルボ  
ニル} オクチル基、8-(ピペリジノカルボニル) オクチル基、9-(N, N-  
ジメチルアミノカルボニル) ノニル基、9-(N, N-ジエチルアミノカルボニ  
ル) ノニル基、9-(1-ピロリジニルカルボニル) ノニル基、9-(N-メチ  
20 ル-N-エチルアミノカルボニル) ノニル基、9-(N-メチル-N-ブチルア  
ミノカルボニル) ノニル基、9-(N-ベンジルアミノカルボニル) ノニル基、  
9-(ピペリジノカルボニル) ノニル基、9-{N-(2-ヒドロキシエチル)  
アミノカルボニル} ノニル基、9-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニ  
ル) ノニル基、9-(モルホリノカルボニル) ノニル基、10-(N, N-ジメ  
25 チルアミノカルボニル) デシル基、10-(N, N-ジエチルアミノカルボニル)  
デシル基、10-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル) デシル基、1  
0-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル) デシル基、10-(N-メ  
チル-N-ブチルアミノカルボニル) デシル基、10-(モルホリノカルボニル)  
デシル基、11-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) ウンデシル基、11

- ー (N, N-ジエチルアミノカルボニル) ウンデシル基、 11- (ピペリジノカルボニル) ウンデシル基、 11- (N-ベンジルアミノカルボニル) ウンデシル基、 11- (N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル) ウンデシル基、 11- {N- (2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル} ウンデシル基、 7- {N- (2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル} ヘプチル基、 7- (N-プロピルアミノカルボニル) ヘプチル基、 7- (N-ヘキシルアミノカルボニル) ヘプチル基、 7- (N-イソペンチルアミノカルボニル) ヘプチル基、 7- (N-イソブチルアミノカルボニル) ヘプチル基、 7- (N-ネオペンチルアミノカルボニル) ヘプチル基、 7- {N- (3-ペンチル) アミノカルボニル} ヘプチル基、 7- (N, N-ジヘキシルアミノカルボニル) ヘプチル基、 7- (N-フェニルアミノカルボニル) ヘプチル基、 7- (N-ベンジルアミノカルボニル) ヘプチル基、 7- {N- (2-フェニルエチル) アミノカルボニル} ヘプチル基、 5- (アミノカルボニル) ペンチル基、 5- (N-ペンチルアミノカルボニル) ペンチル基、 7- (アミノカルボニル) ヘプチル基、 7- (N-ペンチルアミノカルボニル) ヘプチル基、 9- (アミノカルボニル) ノニル基、 9- (N-ペンチルアミノカルボニル) ノニル基、 11- (アミノカルボニル) ウンデシル基、 11- (N-ペンチルアミノカルボニル) ウンデシル基、 13- (アミノカルボニル) トリデシル基、 13- (N-ペンチルアミノカルボニル) トリデシル基、 8- (N-メチル-N-エチルアミノカルボニル) オクチル基、 8- (N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル) オクチル基、 8- (モルホリノカルボニル) オクチル基、 8- (N-メチルアミノカルボニル) オクチル基、 10- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルファニル) デシル基、 7-ヒドロキシヘプチル基、 8-ヒドロキシオクチル基、 9-ヒドロキシノニル基、 7- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ヘプチル基、 7- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ヘプチル基、 9- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ノニル基、 13- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) トリデシル基

- 、
- 4- (カルボキシメトキシ) フェニル基、4- (3-カルボキシプロポキシ) フェニル基、4- (7-カルボキシヘプチルオキシ) フェニル基、
- 4- (カルバモイルメトキシ) フェニル基、4- (3-カルバモイルプロポキシ)
- 5) フェニル基、4- (7-カルバモイルヘプチルオキシ) フェニル基、
- 4- (3-N-ペンチルカルバモイルプロポキシ) フェニル基、4- (7-N-ペンチルカルバモイルヘプチルオキシ) フェニル基、
- 4-メトキシフェニル基、
- 5- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ペンチルオキシ基、7- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ヘ
- 10 プチルオキシ基、13- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) トリデシルオキシ基、
- 7- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ヘプチルオキシ基、13- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) トリ
- 15 デシルオキシ基、
- 4- {5- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ペンチルオキシ} フェニル基、4- {7- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ヘプチルオキシ} フェニル基、4- {5- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ペンチルオキシ} フェニル基、4-
- 20 - {7- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ヘプチルオキシ} フェニル基、
- 3- {3- (3-カルボキシプロポキシ) フェニル} プロピル基、3- {3- (4-カルボキシブトキシ) フェニル} プロピル基、
- 3- [3- {3- (N-メチルアミノカルボニル) プロポキシ} フェニル] プロピル基、3- [3- {3- (N, N-ジメチルアミノカルボニル) プロポキシ} フェニル] プロピル基、3- [3- {3- (1-ピロリジニルカルボニル) プロ
- 25 ポキシ} フェニル] プロピル基、3- [3- {4- (N-メチルアミノカルボニル) ブトキシ} フェニル] プロピル基、3- [3- {4- (N, N-ジメチルアミノカルボニル) ブトキシ} フェニル] プロピル基、及び、3- [3- {4- (

- 1-ピロリジニルカルボニル) ブトキシ} フェニル] プロピル基、  
5- (アミノカルボニル) ペンチルオキシ基、5- (N-ペンチルアミノカルボ  
ニル) ペンチルオキシ基、7- (アミノカルボニル) ヘプチルオキシ基、7- (  
N-ペンチルアミノカルボニル) ヘプチルオキシ基、9- (アミノカルボニル)  
5 ノニルオキシ基、9- (N-ペンチルアミノカルボニル) ノニルオキシ基、11  
- (アミノカルボニル) ウンデシルオキシ基、11- (N-ペンチルアミノカル  
ボニル) ウンデシルオキシ基、13- (アミノカルボニル) トリデシルオキシ基  
、及び、13- (N-ペンチルアミノカルボニル) トリデシルオキシ基  
が好ましく、特に
- 10 7- (N, N-ジメチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7- (N-エチルアミ  
ノカルボニル) ヘプチル基、7- (N-イソプロピルアミノカルボニル) ヘプチ  
ル基、7- (N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7- (N  
、N-ジエチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7- (ピペリジノカルボニル)  
ヘプチル基、7- {N- (2-フリルメチル) アミノカルボニル} ヘプチル基、  
15 7- (N-メチルアミノカルボニル) ヘプチル基、7- (N-メチル-N-エチ  
ルアミノカルボニル) ヘプチル基、7- (N-メチル-N-プロピルアミノカル  
ボニル) ヘプチル基、7- (N-メチル-N-イソプロピルアミノカルボニル)  
ヘプチル基、7- (N-メチル-N-ベンジルアミノカルボニル) ヘプチル基、  
7- (1-ピロリジニルカルボニル) ヘプチル基、7- (モルホリノカルボニル)  
20 ) ヘプチル基、9- (N, N-ジメチルアミノカルボニル) ノニル基、9- (N  
、N-ジエチルアミノカルボニル) ノニル基、9- (N-メチル-N-ブチルア  
ミノカルボニル) ノニル基、9- (N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル)  
ノニル基、9- (モルホリノカルボニル) ノニル基、10- (N, N-ジメチ  
ルアミノカルボニル) デシル基、7- {N- (2-ヒドロキシエチル) アミノカ  
25 ルボニル} ヘプチル基、7- (N-プロピルアミノカルボニル) ヘプチル基、7  
- (N-ベンジルアミノカルボニル) ヘプチル基、7- {N- (2-フェニルエ  
チル) アミノカルボニル} ヘプチル基、3- [3- {3- (N-メチルアミノカ  
ルボニル) プロポキシ} フェニル] プロピル基、3- [3- {3- (N, N-ジ  
メチルアミノカルボニル) プロポキシ} フェニル] プロピル基、及び、3- [3

ー {4- (1-ピロリジニルカルボニル) ブトキシ} フェニル] プロピル基が好ましい。ただし、 $X^1$  及び  $X^2$  は、同時に水素原子であることはない。また、 $X^1$  が水素原子であり、かつ  $X^2$  が上記したもののうち水素原子以外であるもの、及び  $X^1$  が上記したもののうち水素原子以外であり、かつ  $X^2$  が水素原子であるものが特に好ましい。

一般式 (I) で表される化合物としては、17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -{10- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) デシル} -5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -{11- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ウンデシル} -5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -{12- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ドデシル} -5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -{10- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) デシル} -5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -{11- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ウンデシル} -5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -{12- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ドデシル} -5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[10- {N- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} デシル] -5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[11- {N- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} ウンデシル] -5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[9- {N- (5, 5, 6, 6, 6-ペンタフルオロヘキサノイル) アミノ} ノニル] -5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[10- {N- (5, 5, 6, 6, 6-ペンタフルオロヘキサノイル) アミノ} デシル] -5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -{9- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペ

- ンチルスルフィニル) ノニルオキシ} - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -{10-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) デシルオキシ} - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -{11-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ウンデシルオキシ} - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン
- 5 ;
- 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -{9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ノニルオキシ} - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -{10-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) デシルオキシ} - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 10 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -{11-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ウンデシルオキシ} - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[9-{N-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} ノニルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3
- 15 -オン;
- 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[10-{N-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル) アミノカルボニル} デシルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[8-{N-(5, 5, 6, 6, 6-ペンタフル
- 20 オロヘキサノイル) アミノ} オクチルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[9-{N-(5, 5, 6, 6, 6-ペンタフルオロヘキサノイル) アミノ} ノニルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン
- 25 ;
- 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[4-{8-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) オクチルオキシ} フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[4-{9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ノニルオキシ} フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン

－3－オン；

17β－ヒドロキシ－11β－[4－{8－(4, 4, 5, 5, 5－ペンタフル  
オロペンチルスルホニル) オクチルオキシ} フェニル]－5α－アンドロスタン  
－3－オン；

5 17β－ヒドロキシ－11β－[4－{9－(4, 4, 5, 5, 5－ペンタフル  
オロペンチルスルホニル) ノニルオキシ} フェニル]－5α－アンドロスタン－  
3－オン；

10 17β－ヒドロキシ－11β－(4－[8－{N－(4, 4, 5, 5, 5－ペン  
タフルオロペンチル) アミノカルボニル} オクチルオキシ] フェニル)－5α－  
アンドロスタン－3－オン；

17β－ヒドロキシ－11β－(4－[9－{N－(4, 4, 5, 5, 5－ペン  
タフルオロペンチル) アミノカルボニル} ノニルオキシ] フェニル)－5α－ア  
ンドロスタン－3－オン；

15 17β－ヒドロキシ－11β－(4－[7－{N－(5, 5, 6, 6, 6－ペン  
タフルオロヘキサノイル) アミノ} ヘプチルオキシ] フェニル)－5α－アンド  
ロスタン－3－オン；

17β－ヒドロキシ－11β－(4－[8－{N－(5, 5, 6, 6, 6－ペン  
タフルオロヘキサノイル) アミノ} オクチルオキシ] フェニル)－5α－アンド  
ロスタン－3－オン；

20 17β－ヒドロキシ－11β－(6－[4－{N－(4, 4, 5, 5, 5－ペン  
タフルオロペンチル) アミノカルボニル} フェニル] ヘキシル)－5α－アンド  
ロスタン－3－オン；

25 17β－ヒドロキシ－11β－(5－[4－{N－(4, 4, 5, 5, 5－ペン  
タフルオロペンチル) アミノカルボニル} フェニル] ペンチルオキシ)－5α－  
アンドロスタン－3－オン；

17β－ヒドロキシ－11β－トリデシルオキシ－5α－アンドロスタン－3－  
オン；

17β－ヒドロキシ－11β－(11－カルボキシ－15, 15, 16, 16,  
16－ペンタフルオロヘキサデシル)－5α－アンドロスタン－3－オン；



- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-{ {2-ヒドロキシ-3-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニルエチルオキシ) プロピル} オキシ } フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -{4-ヒドロキシ-9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ノニル} - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -(10-カルボキシ-14, 14, 15, 15, 15-ペンタフルオロペンタデシルオキシ) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -(9-カルボキシ-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデシルオキシ) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -(6-カルボキシ-10, 10, 11, 11, 11-ペンタフルオロウンデシル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -(10-カルボキシ-14, 14, 15, 15, 15-ペンタフルオロペンタデシル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -(14-カルボキシ-18, 18, 19, 19, 19-ペンタフルオロノナデシル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -(9-カルボキシノニルオキシ) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -(6-カルボキシヘキシル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -(10-カルボキシデシル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -(14-カルボキシテトラデシル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[3-{4-(4-カルボキシブチル) フェニル} プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[3-{4-(4-カルボキシ-8, 8, 9, 9, 9-ペンタフルオロノニル) フェニル} プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-

3-オン；

17β-ヒドロキシ-11β-{5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ペンチル}-5α-アンドロスタン-3-オン；

5 17β-ヒドロキシ-11β-{9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ノニル}-5α-アンドロスタン-3-オン；

17β-ヒドロキシ-11β-{13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)トリデシル}-5α-アンドロスタン-3-オン；

10 17β-ヒドロキシ-11β-{4-ヒドロキシ-10-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)デシル}-5α-アンドロスタン-3-オン；

17β-ヒドロキシ-11β-(4-ヒドロキシ-15, 15, 16, 16, 16-ペンタフルオロヘキサデシル)-5α-アンドロスタン-3-オン；

15 17β-ヒドロキシ-11β-[9-{N-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル)アミノカルボニル}ノニル]-5α-アンドロスタン-3-オン；

及び17β-ヒドロキシ-11β-[8-{N-(5, 5, 6, 6, 6-ペンタフルオロヘキサノイル)アミノ}オクチル]-5α-アンドロスタン-3-オン、

20 17β-ヒドロキシ-7α-{11-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ウンデシル}-5α-アンドロスタン-3-オン；

17β-ヒドロキシ-7α-{11-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)ウンデシル}-5α-アンドロスタン-3-オン；

17β-ヒドロキシ-7α-{5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ペンチル}-5α-アンドロスタン-3-オン；

25 17β-ヒドロキシ-7α-{9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ノニル}-5α-アンドロスタン-3-オン；

17β-ヒドロキシ-7α-(5-カルボキシペンチル)-5α-アンドロスタン-3-オン；

17β-ヒドロキシ-7α-(7-カルボキシヘプチル)-5α-アンドロスタ

ン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -(9-カルボキシノニル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

5 17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -(11-カルボキシウンデシル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -(13-カルボキシトリデシル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -(9-カルボキシ-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデシル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

10 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -(9-カルボキシ-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデシル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -(9-メトキシカルボニル-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデシル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

15 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -(5-カルボキシペンチルオキシ)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -(7-カルボキシヘプチルオキシ)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

20 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -(10-カルボキシデシルオキシ)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -(11-カルボキシウンデシルオキシ)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -(13-カルボキシトリデシルオキシ)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

25 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -(23-カルボキシトリコサニルオキシ)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -{7-(N, N-ジメチルアミノカルボニル)ヘプチル}-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -{7-(N-エチルアミノカルボニル)ヘプチル}

- 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(シクロプロピルメチル) アミノカルボニル} ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(シクロヘキシルメチル) アミノカルボニル} ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-イソプロピルアミノカルボニル) ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-t-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-シクロヘキシルアミノカルボニル) ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(3-ヒドロキシプロピル) アミノカルボニル} ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(ピペリジノカルボニル) ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(4-t-ブチルベンジル) アミノカルボニル} ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(2, 2-ジフェニルエチル) アミノカルボニル} ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(2-フリルメチル) アミノカルボニル} ヘプチル] — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{7-(N-メチルアミノカルボニル) ヘプチル} — 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-イソプロピルアミノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-ベンジルアミノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(1-ピロリジニルカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(モルホリノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-t-ブチルアミノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-シクロプロピルアミノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[6-(N, N-ジメチルアミノカルボニル)ヘキシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[6-(N, N-ジエチルアミノカルボニル)ヘキシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[6-(ピペリジノカルボニル)ヘキシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[8-(N, N-ジメチルアミノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[8-(N, N-ジエチルアミノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[8-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[8-(N-ベンジルアミノカルボニル)オクチル]

- ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [8- {N- (2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル} オクチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [8- (ピペリジノカルボニル) オクチル] - 5  $\alpha$ -  
5 -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N, N-ジメチルアミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N, N-ジエチルアミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (1-ピロリジニルカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N-メチル-N-エチルアミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル  
15 ) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N-ベンジルアミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (ピペリジノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -  
アンドロスタン-3-オン ;  
20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- {N- (2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル} ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (モルホリノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -  
25 アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [10- (N, N-ジメチルアミノカルボニル) デシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [10- (N, N-ジエチルアミノカルボニル) デシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;

- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[10-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル) デシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[10-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル) デシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[10-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル) デシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[10-(モルホリノカルボニル) デシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) ウンデシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) ウンデシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(ピペリジノカルボニル) ウンデシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(N-ベンジルアミノカルボニル) ウンデシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル) ウンデシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-{N-(2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル} ウンデシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル} ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-プロピルアミノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-ヘキシルアミノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-イソペンチルアミノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-イソブチルアミノカルボニル) ヘプチル]

- ル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N-ネオペンチルアミノカルボニル) ヘプ  
チル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- {N- (3-ペンチル) アミノカルボニル}  
5 ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N, N-ジヘキシルアミノカルボニル) ヘ  
プチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N-フェニルアミノカルボニル) ヘプチル  
] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N-ベンジルアミノカルボニル) ヘプチル  
] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- {N- (2-フェニルエチル) アミノカルボ  
ニル} ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ - (7-カルボキシヘプチル) - 5  $\alpha$ -アンドロス  
15 タン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ - (8-カルボキシオクチル) - 5  $\alpha$ -アンドロス  
タン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ - (9-カルボキシノニル) - 5  $\alpha$ -アンドロス  
タン-3-オン;  
20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ - (1 1-カルボキシウンデシル) - 5  $\alpha$ -アンド  
ロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [5- (アミノカルボニル) ペンチル] - 5  $\alpha$ -ア  
ンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [5- (N-ペンチルアミノカルボニル) ペンチル  
25 ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (アミノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -ア  
ンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N-ペンチルアミノカルボニル) ヘプチル  
] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;



- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-(アミノカルボニル)ノニル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[9-(アミノカルボニル)ノニル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-(N-ペンチルアミノカルボニル)ノニル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[9-(N-ペンチルアミノカルボニル)ノニル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(アミノカルボニル)ウンデシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[11-(アミノカルボニル)ウンデシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(N-ペンチルアミノカルボニル)ウンデシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[11-(N-ペンチルアミノカルボニル)ウンデシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[13-(アミノカルボニル)トリデシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[13-(N-ペンチルアミノカルボニル)トリデシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -{7-(N,N-ジメチルアミノカルボニル)ヘプチル}-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[7-{7-(N-メチルアミノカルボニル)ヘプチル}]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[7-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[7-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[7-(モルホリノカルボニル)ヘプチル]-5

$\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[8-(N,N-ジメチルアミノカルボニル) オクチル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

5 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[8-(N-メチルアミノカルボニル) オクチル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[8-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル) オクチル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[8-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル) オクチル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

10 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[8-(モルホリノカルボニル) オクチル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[9-(N,N-ジメチルアミノカルボニル) ノニル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

15 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[9-(N,N-ジエチルアミノカルボニル) ノニル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[9-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル) ノニル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[9-(N-ベンジルアミノカルボニル) ノニル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

20 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[9-(ピペリジノカルボニル) ノニル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[9-{N-(2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル} ノニル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

25 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[10-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルファニル) デシル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -(7-ヒドロキシヘプチル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -(8-ヒドロキシオクチル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - (9-ヒドロキシノニル) -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ヘプチル] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [13- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) トリデシル] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ヘプチル] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ノニル] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [13- (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) トリデシル] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [4- (カルボキシメトキシ) フェニル] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [4- (3-カルボキシプロポキシ) フェニル] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ - [4- (3-カルボキシプロポキシ) フェニル] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [4- (7-カルボキシヘプチルオキシ) フェニル]
- 20 ] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ - [4- (7-カルボキシヘプチルオキシ) フェニル] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [4- (カルバモイルメトキシ) フェニル] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [4- (カルバモイルメトキシ) フェニル] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [4- (3-カルバモイルプロポキシ) フェニル] -5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ - [4- (3-カルバモイルプロポキシ) フェニル]

- ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-(7-カルバモイルヘプチルオキシ) フェニ  
ル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-(7-カルバモイルヘプチルオキシ) フェ  
5 ニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-(3-N-ペンチルカルバモイルプロポキシ  
) フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-(3-N-ペンチルカルバモイルプロポキシ  
フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-(7-N-ペンチルカルバモイルヘプチルオ  
キシ) フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-(7-N-ペンチルカルバモイルヘプチル  
オキシ) フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-メトキシフェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン  
15 -3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-メトキシフェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタ  
ン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペ  
ンチルスルフィニル) ペンチルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[7-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペ  
ンチルスルフィニル) ヘプチルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロ  
ペンチルスルフィニル) トリデシルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン  
;  
25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[7-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペ  
ンチルスルホニル) ヘプチルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロ  
ペンチルスルホニル) トリデシルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-{5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフル

オロペンチルスルフィニル) ペンチルオキシ} フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-{7-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフル  
5 オロペンチルスルフィニル) ヘプチルオキシ} フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-{5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフル  
オロペンチルスルホニル) ペンチルオキシ} フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-{7-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフル  
10 オロペンチルスルホニル) ヘプチルオキシ} フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-{3-(3-カルボキシプロポキシ) フェニル} プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-{3-(4-カルボキシブトキシ) フェニル  
15 } プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{3-(N-メチルアミノカルボニル) プロポキシ} フェニル] プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{3-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) プロポキシ} フェニル] プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン  
20 ;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{3-(1-ピロリジニルカルボニル) プロポキシ} フェニル] プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{4-(N-メチルアミノカルボニル) ブトキシ} フェニル] プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{4-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) ブトキシ} フェニル] プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{4-(1-ピロリジニルカルボニル) ブトキシ} フェニル] プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[5-(アミノカルボニル) ペンチルオキシ] -

- 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[5-(N-ペンチルアミノカルボニル)ペンチルオキシ]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[7-(アミノカルボニル)ヘプチルオキシ]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
5 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[7-(N-ペンチルアミノカルボニル)ヘプチルオキシ]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[9-(アミノカルボニル)ノニルオキシ]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
10 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[9-(N-ペンチルアミノカルボニル)ノニルオキシ]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[11-(アミノカルボニル)ウンデシルオキシ]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[11-(N-ペンチルアミノカルボニル)ウンデシルオキシ]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
15 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[13-(アミノカルボニル)トリデシルオキシ]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[13-(N-ペンチルアミノカルボニル)トリデシルオキシ]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
20 が好ましく、さらに17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -{10-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)デシル}-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -{9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ノニルオキシ}-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
25 17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -{11-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ウンデシルオキシ}-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；  
；  
17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -{9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)ノニルオキシ}-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン；

- 17β-ヒドロキシ-11β-{11-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)ウンデシルオキシ}-5α-アンドロスタン-3-オン;  
17β-ヒドロキシ-11β-(9-カルボキシ-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデシルオキシ)-5α-アンドロスタン-3-オン;  
5 17β-ヒドロキシ-11β-(9-カルボキシノニルオキシ)-5α-アンドロスタン-3-オン;  
17β-ヒドロキシ-7α-{11-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ウンデシル}-5α-アンドロスタン-3-オン;  
17β-ヒドロキシ-7α-{11-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)ウンデシル}-5α-アンドロスタン-3-オン;  
10 17β-ヒドロキシ-7α-{5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ペンチル}-5α-アンドロスタン-3-オン;  
17β-ヒドロキシ-7α-{9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ノニル}-5α-アンドロスタン-3-オン;  
15 17β-ヒドロキシ-7α-(5-カルボキシペンチル)-5α-アンドロスタン-3-オン;  
17β-ヒドロキシ-7α-(7-カルボキシヘプチル)-5α-アンドロスタン-3-オン;  
17β-ヒドロキシ-7α-(9-カルボキシノニル)-5α-アンドロスタン-3-オン;  
20 17β-ヒドロキシ-7α-(11-カルボキシウンデシル)-5α-アンドロスタン-3-オン;  
17β-ヒドロキシ-7α-(13-カルボキシトリデシル)-5α-アンドロスタン-3-オン;  
25 17β-ヒドロキシ-7α-(9-カルボキシ-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデシル)-5α-アンドロスタン-3-オン;  
17β-ヒドロキシ-11β-(9-カルボキシ-13, 13, 14, 14, 14-ペンタフルオロテトラデシル)-5α-アンドロスタン-3-オン;  
17β-ヒドロキシ-11β-(9-メトキシカルボニル-13, 13, 14,

- 14, 14-ペンタフルオロテトラデシル) - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ - (5-カルボキシペンチルオキシ) - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 5 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ - (7-カルボキシヘプチルオキシ) - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ - (10-カルボキシデシルオキシ) - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ - (11-カルボキシウンデシルオキシ) - 5 $\alpha$ -
- 10 アンドロスタン-3-オン ;
- 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ - (13-カルボキシトリデシルオキシ) - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ - (23-カルボキシトリコサニルオキシ) - 5 $\alpha$ -
- アンドロスタン-3-オン ;
- 15 17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ - {7- (N, N-ジメチルアミノカルボニル) ヘプチル} - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ - {7- (N-エチルアミノカルボニル) ヘプチル} - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ - [7- {N- (シクロプロピルメチル) アミノカルボニル} ヘプチル] - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 20 17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ - [7- {N- (シクロヘキシルメチル) アミノカルボニル} ヘプチル] - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ - [7- (N-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル] - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 25 17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ - [7- (N-イソプロピルアミノカルボニル) ヘプチル] - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ - [7- (N-t-ブチルアミノカルボニル) ヘプチル] - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ - [7- (N-シクロヘキシルアミノカルボニル) ヘ



- プチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(3-ヒドロキシプロピル) アミノカルボニル} ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-プチルアミノカルボニル  
5 ) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(ピペリジノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -  
-アンドロスタン-3-オン;  
10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(4-t-プチルベンジル) アミノカルボニル} ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(2, 2-ジフェニルエチル) アミノカルボニル} ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(2-フリルメチル) アミノカルボニル  
15 } ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{7-(N-メチルアミノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル  
) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-イソプロピルアミノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-ベンジルアミノカルボニル  
25 ) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(1-ピロリジニルカルボニル) ヘプチル]  
- 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(モルホリノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -  
-アンドロスタン-3-オン;

- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-*t*-ブチルアミノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-シクロプロピルアミノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[6-(N, N-ジメチルアミノカルボニル)ヘキシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[6-(N, N-ジエチルアミノカルボニル)ヘキシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[6-(ピペリジノカルボニル)ヘキシル]-5  $\alpha$ -
- 10 -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[8-(N, N-ジメチルアミノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[8-(N, N-ジエチルアミノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[8-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[8-(N-ベンジルアミノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[8-{N-(2-ヒドロキシエチル)アミノカルボニル}オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[8-(ピペリジノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-(N, N-ジメチルアミノカルボニル)ノニル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-(N, N-ジエチルアミノカルボニル)ノニル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-(1-ピロリジニルカルボニル)ノニル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル

- ) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル  
) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-(N-ベンジルアミノカルボニル) ノニル]  
5 - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-(ピペリジノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -  
アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-{N-(2-ヒドロキシエチル) アミノカル  
ボニル} ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニ  
ル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-(モルホリノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -  
アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[10-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) デ  
15 シル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[10-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) デ  
シル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[10-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニ  
ル) デシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[10-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボ  
ニル) デシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[10-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニ  
ル) デシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[10-(モルホリノカルボニル) デシル] - 5  $\alpha$   
25 - アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) ウ  
ンデシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) ウ  
ンデシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(ピペリジノカルボニル)ウンデシル]-  
5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(N-ベンジルアミノカルボニル)ウンデ  
シル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニ  
ル)ウンデシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-{N-(2-ヒドロキシエチル)アミノカ  
ルボニル}ウンデシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(2-ヒドロキシエチル)アミノカル  
10 ボニル}ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-プロピルアミノカルボニル)ヘプチル  
]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-ヘキシルアミノカルボニル)ヘプチル  
]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-イソペンチルアミノカルボニル)ヘプ  
チル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-イソブチルアミノカルボニル)ヘプチ  
ル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-ネオペンチルアミノカルボニル)ヘプ  
20 チル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(3-ペンチル)アミノカルボニル}  
ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N, N-ジヘキシルアミノカルボニル)ヘ  
プチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-フェニルアミノカルボニル)ヘプチル  
]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-ベンジルアミノカルボニル)ヘプチル  
]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(2-フェニルエチル)アミノカルボ

ニル} ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ - (7-カルボキシヘプチル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ - (8-カルボキシオクチル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ - (9-カルボキシノニル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ - (1 1-カルボキシウンデシル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [5- (アミノカルボニル) ペンチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [5- (N-ペンチルアミノカルボニル) ペンチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (アミノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N-ペンチルアミノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (アミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ - [9- (アミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N-ペンチルアミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ - [9- (N-ペンチルアミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [1 1- (アミノカルボニル) ウンデシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ - [1 1- (アミノカルボニル) ウンデシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[11-(N-ペンチルアミノカルボニル)ウンデシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[11-(N-ペンチルアミノカルボニル)ウンデシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[13-(アミノカルボニル)トリデシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[13-(N-ペンチルアミノカルボニル)トリデシル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -{7-(N,N-ジメチルアミノカルボニル)ヘプチル}-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[7-{7-(N-メチルアミノカルボニル)ヘプチル}]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[7-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[7-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[7-(モルホリノカルボニル)ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[8-(N,N-ジメチルアミノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[8-(N-メチルアミノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[8-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[8-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[8-(モルホリノカルボニル)オクチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[9-(N,N-ジメチルアミノカルボニル)ノ

- ニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[9-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) ノ  
ニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[9-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニ  
5 ル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[9-(N-ベンジルアミノカルボニル) ノニル  
] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[9-(ピペリジノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -  
-アンドロスタン-3-オン;  
10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[9-{N-(2-ヒドロキシエチル) アミノカ  
ルボニル} ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[10-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロ  
ペンチルスルファニル) デシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -(7-ヒドロキシヘプチル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタ  
15 ン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -(8-ヒドロキシオクチル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタ  
ン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -(9-ヒドロキシノニル) - 5  $\alpha$ -アンドロスタン  
-3-オン;  
20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペン  
チルスルフィニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペ  
ンチルスルフィニル) トリデシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペン  
25 チルスルホニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[9-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペン  
チルスルホニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペ  
ンチルスルホニル) トリデシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-(カルボキシメトキシ) フェニル] - 5  $\alpha$ -  
アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-(3-カルボキシプロポキシ) フェニル] -  
5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[4-(3-カルボキシプロポキシ) フェニル]  
- 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-(7-カルボキシヘプチルオキシ) フェニル]  
] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[4-(7-カルボキシヘプチルオキシ) フェニ  
10 ル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-(カルバモイルメトキシ) フェニル] - 5  $\alpha$ -  
アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-(カルバモイルメトキシ) フェニル] - 5  $\alpha$ -  
アンドロスタン-3-オン;
- 15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-(3-カルバモイルプロポキシ) フェニル]  
- 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[4-(3-カルバモイルプロポキシ) フェニル]  
] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-(7-カルバモイルヘプチルオキシ) フェニ  
20 ル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[4-(7-カルバモイルヘプチルオキシ) フェ  
ニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-(3-N-ペンチルカルバモイルプロポキシ  
) フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[4-(3-N-ペンチルカルバモイルプロポキシ  
) フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-(7-N-ペンチルカルバモイルヘプチルオ  
キシ) フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[4-(7-N-ペンチルカルバモイルヘプチル



オキシ) フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[4-メトキシフェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-メトキシフェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ペンチルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[7-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ヘプチルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) トリデシルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[7-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ヘプチルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) トリデシルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-{5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ペンチルオキシ} フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-{7-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル) ヘプチルオキシ} フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-{5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ペンチルオキシ} フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-1 1  $\beta$ -[4-{7-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル) ヘプチルオキシ} フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-{3-(3-カルボキシプロポキシ) フェニル]

- ル} プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-{3-(4-カルボキシブトキシ) フェニル  
} プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{3-(N-メチルアミノカルボニル  
5 ) プロポキシ} フェニル] プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{3-(N, N-ジメチルアミノカル  
ボニル) プロポキシ} フェニル] プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン  
;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{3-(1-ピロリジニルカルボニル  
10 ) プロポキシ} フェニル] プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{4-(N-メチルアミノカルボニル  
) ブトキシ} フェニル] プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{4-(N, N-ジメチルアミノカル  
ボニル) ブトキシ} フェニル] プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 15 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{4-(1-ピロリジニルカルボニル  
) ブトキシ} フェニル] プロピル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[5-(アミノカルボニル) ペンチルオキシ] -  
5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[5-(N-ペンチルアミノカルボニル) ペンチ  
20 ルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[7-(アミノカルボニル) ヘプチルオキシ] -  
5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[7-(N-ペンチルアミノカルボニル) ヘプチ  
ルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 25 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[9-(アミノカルボニル) ノニルオキシ] - 5  
 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[9-(N-ペンチルアミノカルボニル) ノニル  
オキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[11-(アミノカルボニル) ウンデシルオキシ]

] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[11-(N-ペンチルアミノカルボニル) ウン  
デシルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[13-(アミノカルボニル) トリデシルオキシ

5 ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[13-(N-ペンチルアミノカルボニル) トリ  
デシルオキシ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

が好ましく、特に

17  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -{7-(N, N-ジメチルアミノカルボニル) ヘプ  
10 チル} - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -{7-(N-エチルアミノカルボニル) ヘプチル}  
- 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-イソプロピルアミノカルボニル) ヘプ  
チル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

15 17  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル  
) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N, N-ジエチルアミノカルボニル) ヘプ  
チル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(ピペリジノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$   
20 - アンドロスタン-3-オン;

17  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(2-フリルメチル) アミノカルボニ  
ル} ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{7-(N-メチルアミノカルボニル) ヘプ  
チル} - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

25 17  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-エチルアミノカルボニル  
) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-プロピルアミノカルボニ  
ル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

17  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-メチル-N-イソプロピルアミノカル

- ボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N-メチル-N-ベンジルアミノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (1-ピロリジニルカルボニル) ヘプチル]  
5 - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (モルホリノカルボニル) ヘプチル] - 5  $\alpha$ -  
-アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N, N-ジメチルアミノカルボニル) ノニル]  
- 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N, N-ジエチルアミノカルボニル) ノニル]  
- 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル)  
) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル)  
15 ル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (モルホリノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -  
-アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [10- (N, N-ジメチルアミノカルボニル) デ  
シル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- {N- (2-ヒドロキシエチル) アミノカル  
ボニル} ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N-プロピルアミノカルボニル) ヘプチル]  
] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N-ベンジルアミノカルボニル) ヘプチル  
25 ] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- {N- (2-フェニルエチル) アミノカルボ  
ニル} ヘプチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;  
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ - [9- (N, N-ジエチルアミノカルボニル) ノ  
ニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;

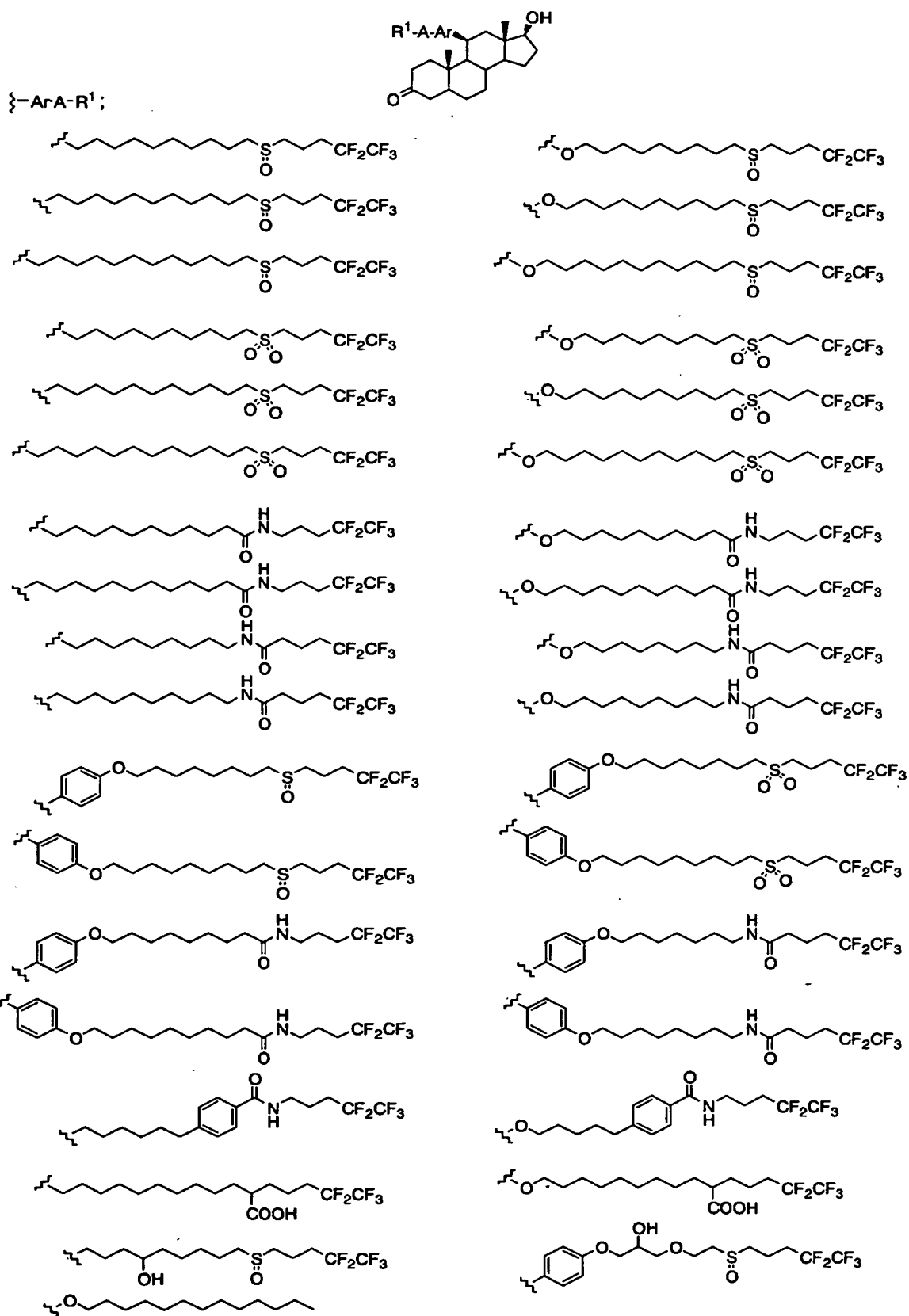
17β-ヒドロキシ-7α-[3-[3-{3-(N-メチルアミノカルボニル)プロポキシ}フェニル]プロピル]-5α-アンドロスタン-3-オン；

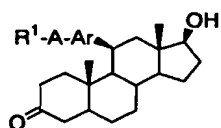
17β-ヒドロキシ-7α-[3-[3-{3-(N,N-ジメチルアミノカルボニル)プロポキシ}フェニル]プロピル]-5α-アンドロスタン-3-オン

5 ;

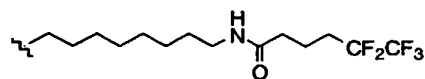
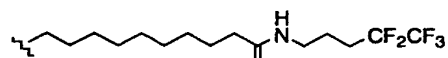
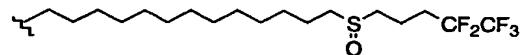
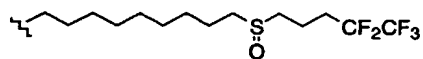
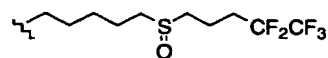
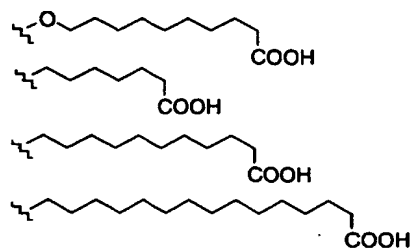
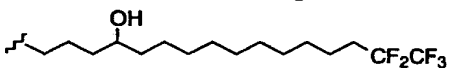
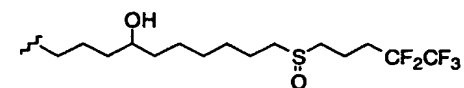
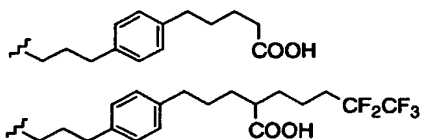
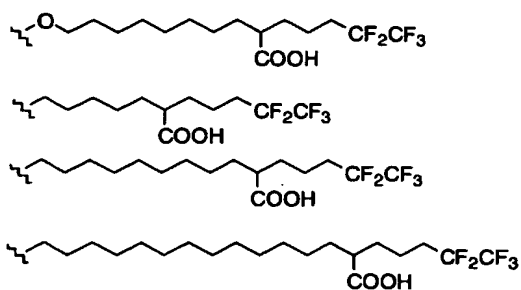
17β-ヒドロキシ-7α-[3-[3-{4-(1-ピロリジニルカルボニル)ブトキシ}フェニル]プロピル]-5α-アンドロスタン-3-オン；

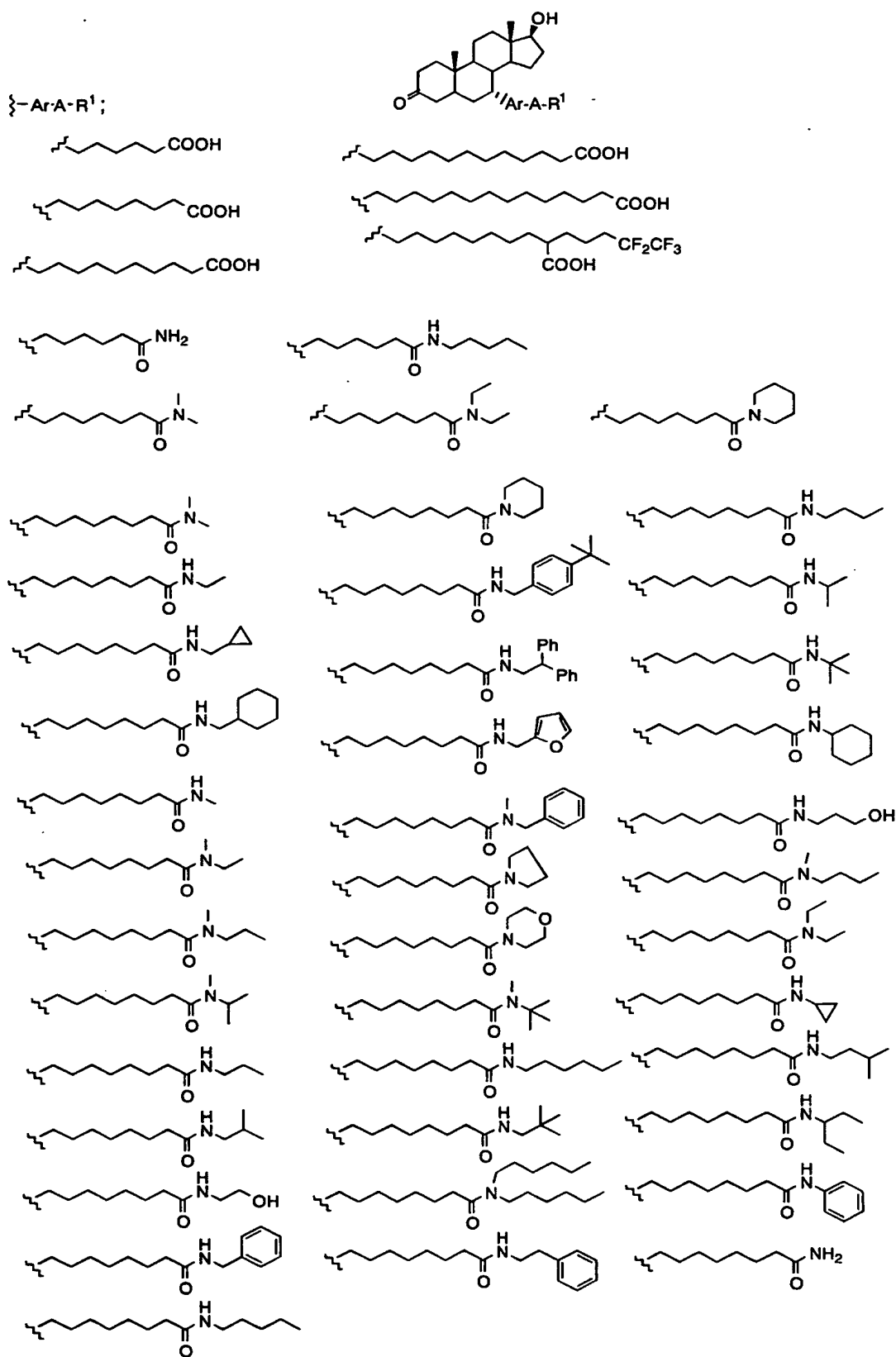
が好ましい。これらの化合物の構造を以下に示す：





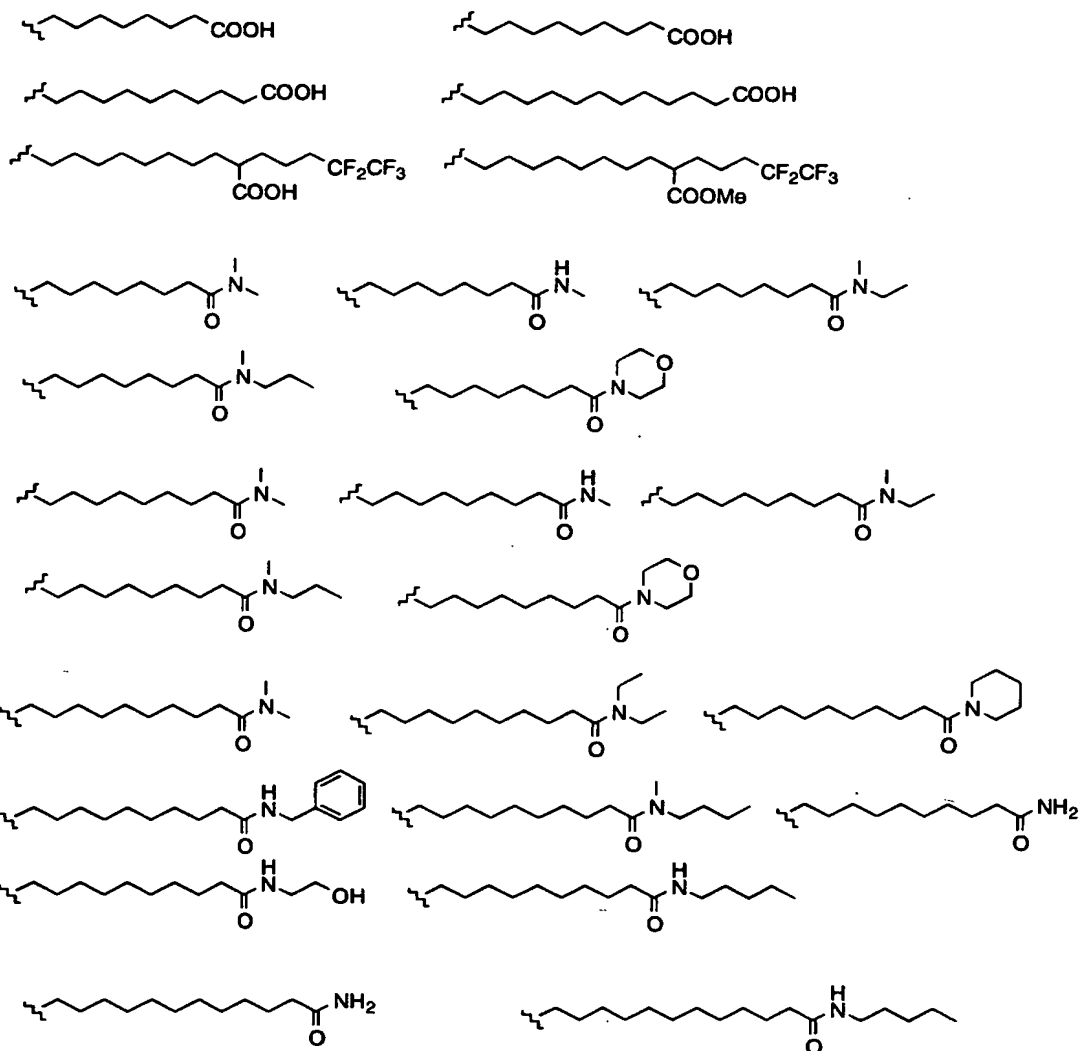
$\{-ArA-R^1\}$ ;



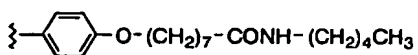
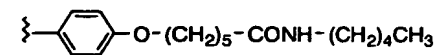
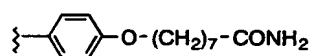
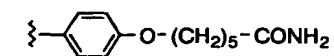
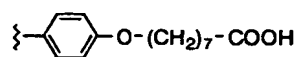
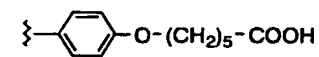
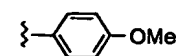
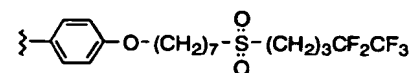
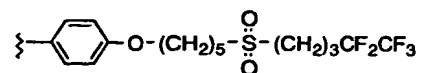
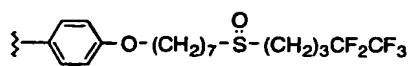
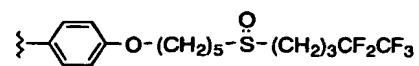
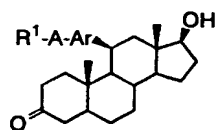


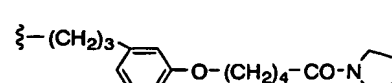
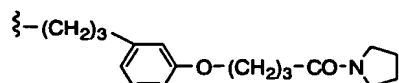
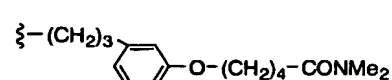
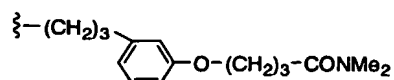
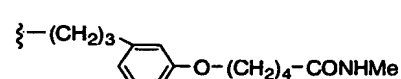
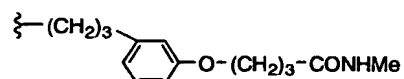
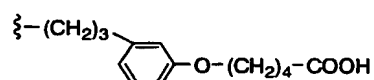
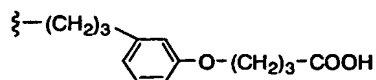
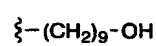
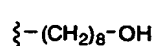
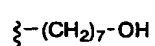
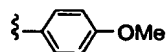
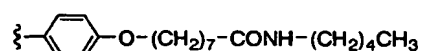
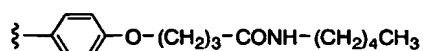
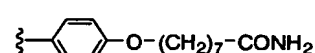
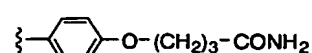
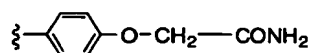
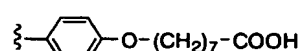
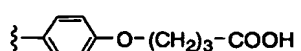
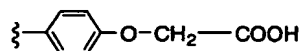
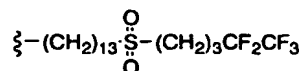
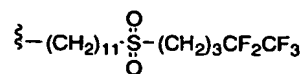
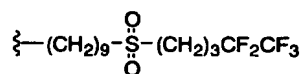
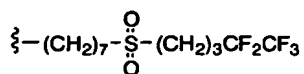
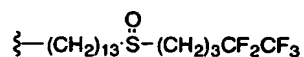
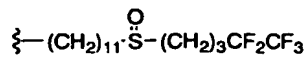
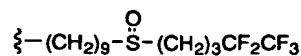
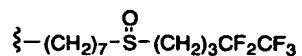
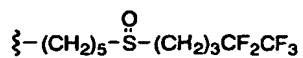
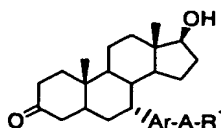










$\xi$ -ArA-R<sup>1</sup> ;

一般式 (I) で表される化合物が、分子内に 1 個以上の不斉炭素原子を含有する場合、各々の不斉炭素原子について、その絶対配置が R 配置、及び S 配置であるもの、並びにそれらの任意の割合の混合物の全てが、本発明に包含される。

本発明の、アンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、アゴニストとして作用しない物質において、アゴニストとして作用しないとは、以下のアンドロゲンレセプターレポータージーンアッセイ法において、0.1 nmol/L ~ 10  $\mu$ mol/Lのいずれかの濃度で、転写活性値が、無添加の転写活性値を1とした場合、その1 ~ 5 倍の値を示すことを意味する：

トランスフェクションの24時間前に、 $1.0 \times 10^5$ 個のHeLa細胞（大日本製薬（株）より購入）を12ウェルのマイクロプレート中でチャコール処理したFBS（DCC-FBS）5%を含むフェノールレッドを含まないDulbecco's Modified Eagle Medium（phenol red free DMEM）で培養する。500 ng/wellのMMTV-Lucベクター（アンドロゲンレスポンスエレメントを含むMouse tumor Long terminal repeatを持つルシフェラーゼのレポータープラスミド：A. T. C. C. より購入したGM-CATベクター（A. T. C. C. No. 67282）のクロラムフェニコールアセチルトランスフェラーゼ遺伝子をホタルルシフェラーゼ遺伝子に置換したベクター）と100 ng/wellのpSG5-hAR（ヒトのアンドロゲン受容体の発現ベクターでSV40プロモーターの制御下にアンドロゲンレセプター遺伝子を有す）、5 ng/wellのRenilla Luc vector（ウミシイタケルシフェラーゼ遺伝子が組み込まれた内部標準用ベクター）をHeLa細胞にトランスフェクションする。トランスフェクションはphenol red free DMEM培養液中で3 mL/wellのリポフェクトアミン（GibcoBRL）を用いて行う。トランスフェクションの9時間後に培養液を、10 mmol/Lの本発明の一般式（I）で表される化合物、又は本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、アゴニストとして作用しない物質を含むphenol red free DMEM / 3%DCC-FBSに交換する。培養液交換の48時間後に転写活性値を測定する。転写活性はDual-Luciferase Reporter Assay System（promega）で測定する。（転写活性値）＝（ホタルルシフェラーゼの値）／（ウミシイタケルシフェラーゼの値）と定義する。このアッセイ法の実施にあたっては、J. Biol. Chem., vol. 270, p. 19998-20003, 1995を参照することができる。

WO 97/49709号公報には、アンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、アゴニストとして作用しない物質として、ハイドロキシフルタミド（フルタミドのin vivoでの活性本体）及びピカルタミドが記載されているが

、該公報におけるアゴニストとして作用しないとは、CV-1細胞を用いたアンドロゲンレポータージーンアッセイ法において、 $10\mu\text{mol/L}$ 以上の濃度で、下記式で表されるアゴニスト効率値が、0～20%であることと定義されており、本発明におけるアゴニストとして作用しないことの定義とは明確に峻別される：

- 5     アゴニスト効率 (%) = (スクリーニングした非ステロイド化合物の転写活性値) / (DHTによる最大転写活性値)  $\times 100$ 。

また、本発明のアゴニストとして作用しないことの定義で用いたアンドロゲンレセプターレポータージーンアッセイ法において、ハイドロキシフルタミド及びビカルタミドは、それぞれ $10\mu\text{mol/L}$ の濃度で、アゴニストとして作用すると認め  
10    られた (本明細書の実施例 1 参照)。

また、アンタゴニストとして作用するとは、以下のアンドロゲンレセプターレポータージーンアッセイ法において、 $0.1\text{nmol/L}$ ～ $10\mu\text{mol/L}$ のいずれかの濃度で、 $0.1\text{nmol/L}$ のジヒドロテストステロン (DHT) の転写活性値を0～50%に抑制することを意味する：

- 15    トランスフェクションの24時間前に、 $1.0 \times 10^5$ 個のHeLa細胞を12ウェルのマイクロプレート中でphenol red free DMEM/5%DCC-FBSで培養する。 $500\text{ng/well}$ のMMTV-Lucベクターと $100\text{ng/well}$ のpSG5-hAR、 $5\text{ng/well}$ のRenilla Luc vectorをHeLa細胞にトランスフェクションする。トランスフェクションはphenol red free DMEM培養液中で $3\text{L/well}$ のリポフェクトアミンを用いて行う。トランスフェクションの  
20    9時間後に培養液を、 $0.1\text{nmol/L}$ のDHT、 $1.0\mu\text{mol/L}$ の本発明の一般式 (I) で表される化合物、又は本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、アゴニストとして作用しない物質を含むphenol red free DMEM/3%DCC-FBSに交換する。培養液交換の48時間後に転写活性値を測定する。転写活性はDual-Luciferase Reporter Assay Systemで測定する。(転写活性値) = (ホタルルシフェラーゼの値) / (ウミシイタケルシフェラーゼの値) とする。このアッセイ法の実施にあたっては、J. Biol. Chem., vol. 270, p. 19998-20003, 1995を参照  
25    することができる。

本発明の、アンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、アゴニストとして作用しない物質の具体例としては、例えば、本発明の一般式 (I) で

表される化合物が挙げられる。

本発明の一般式 (I) で表される化合物、及び本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、アゴニストとして作用しない物質は、その薬学上許容し得る塩としても得ることができる。薬学上許容し得る塩としては、

5 塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、硫酸塩、及びリン酸塩等の無機酸塩；  
ギ酸塩、酢酸塩、シュウ酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、メタンスルホン酸塩、  
ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、コハク酸塩、マロン酸塩、  
クエン酸塩、グルコン酸塩、マンデル酸塩、安息香酸塩、サリチル酸塩、トリ  
10 フルオロ酢酸塩、酒石酸塩、プロピオン酸塩、及びグルタル酸等の有機酸塩；ナ  
トリウム塩、カリウム塩、マグネシウム塩、及び亜鉛塩等の無機塩基塩；並びに  
アンモニウム塩等の有機塩基塩などが挙げられる。

本発明の一般式 (I) で表される化合物、及びその薬学上許容し得る塩、並びに本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、アゴニストとして作用しない物質、及びその薬学上許容し得る塩は、それらのプロドラッグとしても得ることができる。プロドラッグとは、生体内で急速に変換して一般

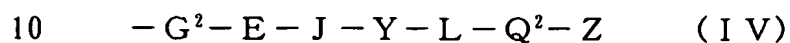
15 式 (I) で表される化合物、及びその薬学上許容し得る塩、並びに本発明のアン  
ドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、アゴニストとして作用し  
ない物質、及びその薬学上許容し得る塩を、たとえば血液内での加水分解により  
生成する化合物を意味する。T. Higuchi及びV. Stellaは、“Prodrugs as Novel  
20 Delivery Systems, vol. 14 of the A. C. S. Symposium Series, American Chemical  
Society (1975) にプロドラッグの概念を詳しく説明している。これらのプロドラ  
ッグはそれ自身活性を有することもあれば有しないこともあるが、普通には殆ど  
活性を有しない。また、例えば、ウイルマン (D. E. V. Wilman, 「癌化学療法にお  
けるプロドラッグ」、バイオケミカル・ソサイエティー・トランスアクションズ  
25 (Biochemical Society Transactions), vol. 14, pp. 375-382 [第615会議 (615th  
Meeting, Belfast), 1986] 及びステラ (V. J. Stella) ほか、「プロドラッグ：  
標的指向薬剤供給に対する化学的方法」、ディレクテッド・ドラッグ・デリバリ  
ー (Directed Drug Delivery), ボルチャート (R. Borchardt) ほか編, pp. 247  
-267、ヒュマナ・プレス (Humana Press) 1985を参照することもできる。プロド



ラッグの具体例としては、例えば一般式 (I) で表される化合物が  $-COOH$  部分構造を有する場合、そのエステル、カーボネート、カーバメート等が挙げられる。

本発明の一般式 (I) で示される化合物は、例えば以下に示す A 法～W 法、B  
5 ' 法～L' 法、S' 法～W' 法、U' ' 法、W' ' 法及び W' ' ' 法、又は目的化合物に応じて A 法～W 法、B' 法～L' 法、S' 法～W' 法、U' ' 法、W' ' 法及び W' ' ' 法を適宜一部変更した方法に従って製造することができる。

A 法～W 法、B' 法～L' 法、S' 法～W' 法、U' ' 法、W' ' 法及び W' ' ' 法において記載されている化学式中、 $R^2$  は、一般式 (IV)



(式中、 $G^2$  は、単結合、炭素数 1～26 の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基、炭素数 2～26 の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基、又は炭素数 2～26 の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基を示し、E、J、Y、L、 $Q^2$ 、及び Z は前記と同義である。なお、 $Q^2$  における  $R^7$  及び  $R^8$  は、好適には水素原子で  
15 ある。) を示し、 $R^3$  は、置換シリル基を示し、好適には、t-ブチルジメチルシリル基である。 $X^3$  は、ハロゲン原子又は置換スルホネート基を示し、好適には、p-トルエンスルホネート基又はメタンスルホネート基である。 $R^{12}$  は、炭素数 1～6 の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示し、好適には、メチル基及びエチル基である。 $R^6$  及び  $R^7$  は、それらが結合している 3 位及び 17 位の炭素  
20 原子と一緒にあって、保護されている  $-(C=O)-$  を示し、好ましくは 1, 3-ジオキサン、1, 3-ジオキソラン、及び 1, 3-ジチアン等であり、特に好ましくは 1, 3-ジオキソラン等である。 $L^2$  は、炭素数 1～10 の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキレン基を示し、好適には、エタン-1, 2-ジイル基、プロパン-1, 3-ジイル基及びブタン-1, 4-ジイル基である。

25  $R^4$  は、一般式 (V)



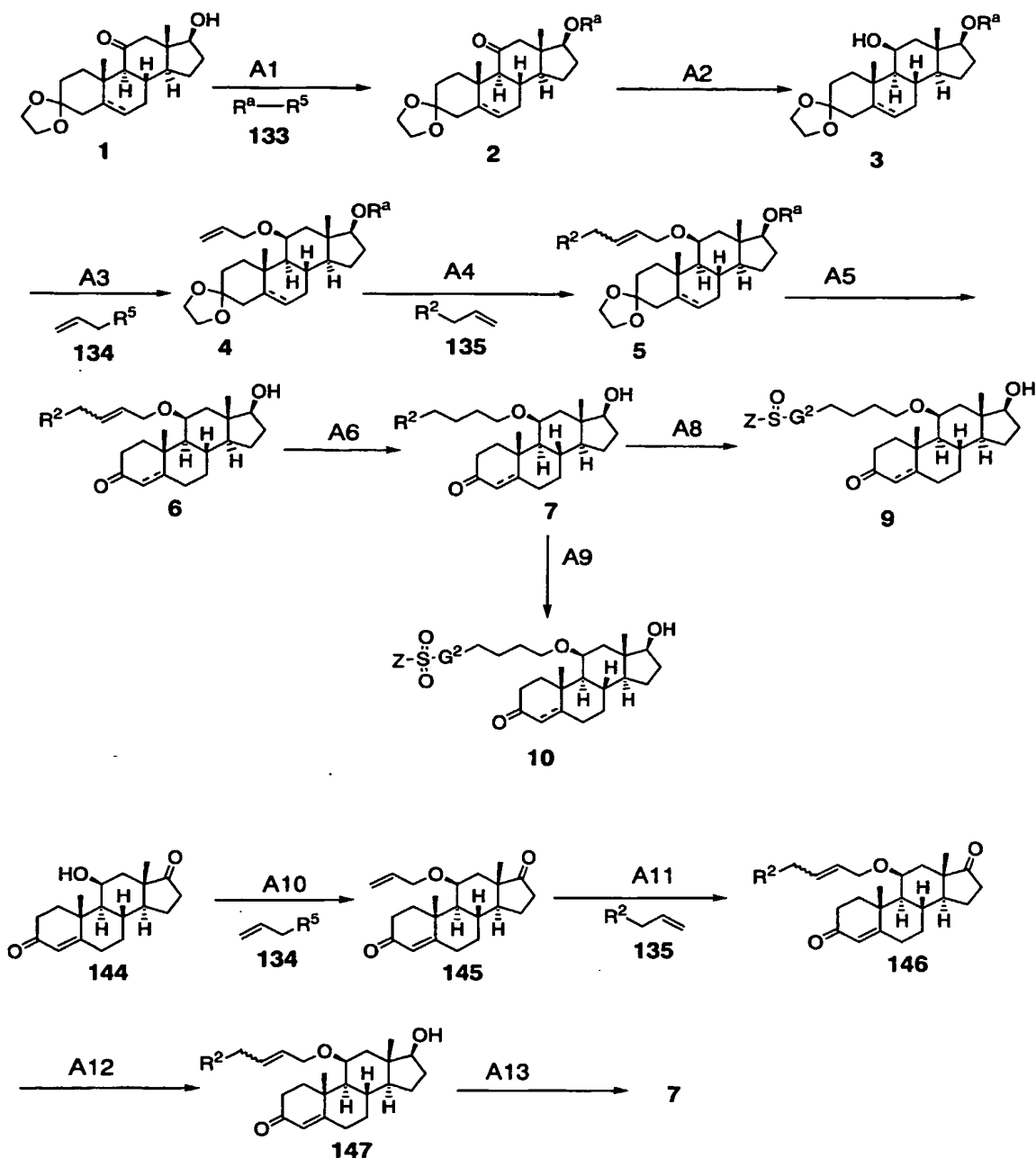
(式中、 $G^3$  は、炭素数 1～27 の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基、炭素数 2～27 の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基、又は炭素数 2～27 の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基を示し、E、J、Y、L、 $Q^2$  及び Z は前記

と同義である。)を示す。 $R^5$ は、ハロゲン原子を示し、好適には臭素原子又はヨウ素原子である。 $R^6$ は置換シリル基を示し、好適にはトリメチルシリル基である。 $R^{13}$ はハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示し、好適にはトリフルオロメチル基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ノナフルオロプロピル基である。 $R^{14}$ は $-MgR^5$ 、 $-ZnR^5$ 、 $-Sn(R^7)_3$ で示される基を示し、好適には $-Sn(R^7)_3$ で示される基である。 $G^4$ は炭素数1～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基、炭素数2～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基、又は炭素数2～30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基を示す。波線は、二重結合に対してトランス配置又はシス配置の単結合を示し、好適にはトランス配置である。

A法は、一般式(I)で表わされる化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-CH_2-CH=CH-CH_2-R^2$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(6)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4-R^2$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(7)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4-G^2-S(O)-Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(9)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4-G^2-S(O)_2-Z$ であり、 $X$

<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって—(C=O)—であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(10)、並びに一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、A<sub>r</sub>が単結合であり、Aが—O—であり、R<sup>1</sup>が—CH<sub>2</sub>—CH=CH—CH<sub>2</sub>—R<sup>2</sup>であり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって—(C=O)—であり、破線が実線と共に二重結合である化合物(147)を製造する方法である。

## A法



第A1工程は、化合物(2)を製造する工程で、不活性溶媒中、塩基の存在下  
5、化合物(1)と化合物(133)を反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、本反応に関与しないものであれば特に限定しないが、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、

エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒であり、好適にはジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒であり、さらに好適にはジクロロメタンである。使用される塩基は、例えばジイソプロピルエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジン、ピリジン、トリエチルアミン、N-メチルモリホリンのような有機塩基であり、好適にはジイソプロピルエチルアミンである。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、0℃～50℃であり、好適には10℃～30℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分間～24時間であり、好適には30分間～15時間である。

第A2工程は、化合物(3)を合成する工程で、不活性溶媒中、化合物(2)と還元剤を反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しないものであれば特に限定されないが、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、メタノール、エタノールのようなアルコール系溶媒であり、好適にはエーテル、テトラヒドロフランであり、さらに好適にはエーテルである。使用される還元剤は、例えば、水素化アルミニウムリチウム、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム、水素化トリ-tert-ブトキシアルミニウムリチウム、水素化アルミニウムリチウム-トリクロロアルミニウム(アラン)、水素化アルミニウムリチウム-三フッ化ホウ素、水素化アルミニウム塩化マグネシウム、水素化アルミニウムマグネシウム、水素化アルミニウムナトリウム、水素化トリエトキシアルミニウムナトリウム、水素化ビス(メトキシエトキシ)アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム-パラジウム/炭素、硫化水素化ホウ素ナトリウム、シアン化水素化ホウ素ナトリウム、水素化トリメトキシホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、シアン化水素化ホウ素リチウム、水素化トリエチルホウ素リチウム、水素化トリ-tert-ブチルホウ素リチウム、水素化トリ-tert-ブチルホウ素リチウム、水素化ホウ素カルシウム、水素化ホウ素カリウム、水素化トリイソプロポキシホウ素カリウム、水素化トリ-tert-ブチルホウ素カリウム、水素化ホウ素亜鉛、水素化ホウ素テトラメチルア

ンモニウム、水素化シアノホウ素テトラ-*n*-ブチルアンモニウムのような金属水素錯化合物、水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化トリフェニルスズ、水素化トリ-*n*-ブチルスズ、水素化ジフェニルスズ、水素化ジ-*n*-ブチルスズ、水素化トリエチルスズ、水素化トリメチルスズ、トリクロシラン/トリ-*n*-ブチルアミン、トリクロロシラン/トリ-*n*-プロピルアミン、トリエチルシラン、トリメチルシラン、ジフェニルシラン、フェニルシラン、ポリメチルヒドロシロキサン、ジメチルフェニルシラン、ジ-*n*-ブチルシラン、メチルフェニルシランのような金属水素化物、ジボラン、ジメチルアミン-ボラン、トリメチルアミン-ボラン、エチレンジアミン-ボラン、ピリジン-ボラン、ジメチルスルフィド-ボラン、2, 3-ジメチル-2-ブチルボラン(*thexylborane*)、ビス-3-メチル-2-ブチルボラン(*disiamylborane*)、ジイソピノカンフェニルボラン、ジシクロヘキシルボラン、9-ボラビシクロ[3, 3, 1]ノナン(9-BBN)のようなボラン誘導体であり、好適には水素化アルミニウムリチウム、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム、水素化トリ-*t*-ブトキシアルミニウムリチウム、水素化アルミニウムリチウム-トリクロロアルミニウム(アラン)、水素化アルミニウムリチウム-三フッ化ホウ素、水素化アルミニウム塩化マグネシウム、水素化アルミニウムマグネシウム、水素化アルミニウムナトリウム、水素化トリエトキシアルミニウムナトリウム、水素化ビス(メトキシエトキシ)アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム-パラジウム/炭素、硫化水素化ホウ素ナトリウム、シアン化水素化ホウ素ナトリウム、水素化トリメトキシホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、シアン化水素化ホウ素リチウム、水素化トリエチルホウ素リチウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素リチウム、水素化トリ-*t*-ブチルホウ素リチウム、水素化ホウ素カルシウム、水素化ホウ素カリウム、水素化トリイソプロポキシホウ素カリウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素カリウム、水素化ホウ素亜鉛、水素化ホウ素テトラメチルアンモニウム、水素化シアノホウ素テトラ-*n*-ブチルアンモニウムのような金属水素錯化合物であり、さらに好適には水素化アルミニウムリチウムである。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、-30℃~100℃であり、好適には0℃~70℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常1

0 分間～4 8 時間であり、好適には3 0 分間～2 4 時間である。

また、この工程で副生する、化合物(3)の1 1 位の水酸基が $\alpha$ 配置である化合物を用いることにより、化合物(6)、化合物(7)、化合物(9)、及び化合物(1 0)のX'が $\alpha$ 配置である化合物を得ることができる。

- 5 第A 3 工程は、化合物(4)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(3)に塩基を反応させることにより得られる化合物(3)の塩を、不活性溶媒中、化合物(1 3 4)と反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しなければ特に限定されないが、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等であり、  
10 好適にはエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等である。使用される塩基は、水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウムのような金属水素化物、メチルリチウム、エチルリチウム、n-ブチルリチウム、t-ブチルリチウムのようなアルキルリチウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化バリウム、水酸化セシウムのような金属水酸化物、ナトリウムアミド、カリウムビストリメチルシリルアミド、ナトリウムビストリメチルシリルアミド、リチウムジイソプロピルアミドのような金属アミド、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]-7-ウンデセン、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、ピラジンのようなアミン類、四ホウ酸ナトリウム、ヨウ化ナトリウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、ナトリウムヘキサメチルジシラザン、カリウムヘキサメチルジシラザン等であり得、好適には水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウムのような金属水素化物、メチルリチウム、エチルリチウム、n-ブチルリチウム、t-ブチルリチウムのようなアルキルリチウム

15  
20  
25

である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $-30^{\circ}\text{C}\sim 100^{\circ}\text{C}$ であり、好適には $0^{\circ}\text{C}\sim 70^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分間～48時間であり、好適には30分間～24時間である。

第A4工程は、化合物(5)を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物(4)と化合物(135)を反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しないものであれば特に限定されないが、好適にはジクロロメタン、クロロホルムのようなハロゲン系溶媒、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒等であり、さらに好適にはジクロロメタン、ジメトキシエタン等である。使用される有機金属触媒は、好適には、ベンジリデンービス(トリシクロヘキシルホスフィン)ージクロロルテニウムである。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $-30^{\circ}\text{C}\sim 100^{\circ}\text{C}$ であり、好適には $0^{\circ}\text{C}\sim 80^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分間～48時間であり、好適には30分間～24時間である。

第A5工程は、化合物(6)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(5)を酸と反応させるとこにより達成される。

使用される溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定されないが、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル系溶媒、メタノール、エタノールのようなアルコール系溶媒又はアセトンのようなケトン系溶媒と水との混合溶媒であり得、好適には、含水アセトンである。

使用される酸は、例えば、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、リン酸のような無機酸、酢酸、p-トルエンスルホン酸、ピリジニウム-p-トルエンスルホネートのような有機酸であり得、好適には、塩酸である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $0^{\circ}\text{C}\sim 100^{\circ}\text{C}$ (好適には、 $30^{\circ}\text{C}\sim 80^{\circ}\text{C}$ )である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間(好適には、30分間～10時間)である。

第A6工程は、化合物(7)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成される。



使用される溶媒は、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール、*i*-プロパノール、*n*-ブタノール、*s*-ブタノール、*t*-ブタノール、ペンタノール、ヘキサノール、シクロプロパノール、シクロブタノール、シクロペンタノール、シクロヘキサノール、エチレングルコール、1, 3-プロパンジオール、1, 4-ブタンジオール、1, 5-ペンタンジオールのようなアルコール系溶媒、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、*N*-メチルピロリドン、酢酸エチル、アセトニトリル、ニトロメタンであり得、好適には、エタノール、ジオキサン、ベンゼン、酢酸エチル等である。

接触還元を用いる条件は、水素-クロロトリス(トリフェニルホスフィン)ロジウム(I)、水素-クロロトリス(トリパラトリルホスフィン)ロジウム(I)、水素-クロロトリス(トリパラメトキシフェニルホスフィン)ロジウム(I)、水素-ヒドリドカルボニルトリス(トリフェニルホスフィン)ロジウム(I)、水素-酢酸ロジウム(II)、水素-酢酸ルテニウム(II)、水素-クロロヒドリドトリス(トリフェニルホスフィン)ルテニウム(II)、水素-カルボキシラトヒドリドトリス(トリフェニルホスフィン)ルテニウム(II)、水素-ヒドリドカルボニルトリス(トリフェニルホスフィン)イリジウム(I)、水素-白金(II)-塩化スズ錯体、水素-ペンタシアノコバルト(II)錯体、水素-トリシアノピピリジンコバルト(II)錯体、水素-ビス(ジメチルグリオキシマト)コバルト(II)錯体、水素-安息香酸メチル-トリカルボニルクロム錯体、水素-ビス(トリカルボニルシクロペンタジエニルクロム)、水素-ペンタカルボニル鉄、水素-ビス(シクロペンタジエニル)ジカルボニルチタン、水素-ヒドリドカルボニルコバルト錯体、水素-オクタカルボニルニコバルト、水素-ヒドリドカルボニルロジウム、水素-クロム(III)アセチルアセトナート-トリイソブチルアルミニウム、水素-コバルト(II)アセチルアセトナート-トリイソブチルアルミニウム、水素-ニッケル(II)-2-ヘキサ

ノアートートリエチルアルミニウム等の均一系、水素-二酸化白金、水素-白金/炭素、水素-パラジウム/炭素、水素-パラジウム/硫酸バリウム、水素-パラジウム/炭酸カルシウム、水素-ラネ-ニッケル、水素-カッパークロマイト、水素-ロジウム/炭素、水素-ロジウム/アルミナ、水素-二酸化ルテニウム、水素-ルテニウム/炭素等の不均一系条件であり得、好ましくは水素-クロロトリス(トリフェニルホスフィン)ロジウム(I)、水素-パラジウム/炭素、水素-パラジウム/炭酸カルシウム等である。

反応温度は、通常0℃～100℃であり、好適には0℃～60℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、10分間～24時間であり、好適には10分間～6時間である。

第A8工程は、化合物(7)のR<sup>2</sup>におけるQ<sup>2</sup>が-S-である場合、化合物(9)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(7)を酸化剤と反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しなければ特に限定されないが、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、メタノール、エタノールのようなアルコール系溶媒、テトラヒドロフランのようなエーテル系溶媒、水又はこれらの混合溶媒であり得、好適にはジクロロメタン、メタノール、テトラヒドロフラン-水混合溶媒等である。

使用される酸化剤は、例えば、過安息香酸t-ブチル、過酢酸t-ブチル、t-ブチルヒドロペルオキシド、t-アミルヒドロペルオキシド、ジベンゾイルペルオキシド、ジ-p-ニトロベンゾイルペルオキシド、ジ-p-クロロベンゾイルペルオキシドのような有機過酸化物、過安息香酸、メタクロロ過安息香酸、p-ニトロ過安息香酸、モノペルオキシフタル酸、過ギ酸、過酢酸、トリフルオロ過酢酸、ペルオキシラウリン酸のような有機過酸、次亜塩素酸、次亜塩素酸ナトリウム、次亜臭素酸カリウム、次亜ヨウ素酸カリウム、塩素酸ナトリウム、塩素酸カリウム、臭素酸ナトリウム、臭素酸カリウム、ヨウ素酸ナトリウム、ヨウ素酸カリウム、フッ化ペルクロリル、オルト過ヨウ素酸、メタ過ヨウ素酸ナトリウム、メタ過ヨウ素酸カリウム、N-ブロモアセトアミド、N-ブロモスクシンイ

ミド、N-ブロモフタルイミド、イソシアヌルクロリド、イソシアヌルブロミド、N-ブロモカプロラクタム、1-クロロベンゾトリアゾール、1, 3-ジブromo-5, 5-ジメチルヒダントイン、ナトリウムN-クロロ-p-トルエンスルホンアミド（クロラミンT）、ナトリウムN-クロロベンゼンスルホンアミド（クロラミンB）、次亜塩素酸t-ブチル、次亜臭素酸t-ブチル、次亜ヨウ素酸t-ブチル、酢酸ヨードシルベンゼン、ヨードシルベンゼンのようなハロゲン類、ペルオキソー硫酸、OXONE（登録商標）、過酸化水素等であり、好適には、過ヨウ素酸ナトリウム、OXONE（登録商標）等である。

反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、-20℃～30℃（好適には、-10℃～10℃）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間（好適には、30分間～15時間）である。

第A9工程は、化合物（7）のR<sup>2</sup>におけるQ<sup>2</sup>が-S-である場合、化合物（10）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（7）を酸化剤と反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しなければ特に限定されないが、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、メタノール、エタノールのようなアルコール系溶媒、テトラヒドロフランのようなエーテル系溶媒、水又はこれらの混合溶媒であり得、好適にはジクロロメタン、メタノール、テトラヒドロフラン-水混合溶媒等である。

使用される酸化剤は、例えば、過安息香酸t-ブチル、過酢酸t-ブチル、t-ブチルヒドロペルオキシド、t-アミルヒドロペルオキシド、ジベンゾイルペルオキシド、ジ-p-ニトロベンゾイルペルオキシド、ジ-p-クロロベンゾイルペルオキシドのような有機過酸化物、過安息香酸、メタクロロ過安息香酸、p-ニトロ過安息香酸、モノペルオキシフタル酸、過ギ酸、過酢酸、トリフルオロ過酢酸、ペルオキシラウリン酸のような有機過酸、次亜塩素酸、次亜塩素酸ナトリウム、次亜臭素酸カリウム、次亜ヨウ素酸カリウム、塩素酸ナトリウム、塩素酸カリウム、臭素酸ナトリウム、臭素酸カリウム、ヨウ素酸ナトリウム、ヨウ素酸カリウム、フッ化ペルクロリル、オルト過ヨウ素酸、メタ過ヨウ素酸ナトリウ

ム、メタ過ヨウ素酸カリウム、N-ブロモアセトアミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ブロモフタルイミド、イソシアヌルクロリド、イソシアヌルブロミド、N-ブロモカプロラクタム、1-クロロベンゾトリアゾール、1, 3-ジブromo-5, 5-ジメチルヒダントイン、ナトリウムN-クロロ-p-トルエンスルホンアミド（クロラミンT）、ナトリウムN-クロロベンゼンスルホンアミド（クロラミンB）、次亜塩素酸t-ブチル、次亜臭素酸t-ブチル、次亜ヨウ素酸t-ブチル、酢酸ヨードシルベンゼン、ヨードシルベンゼンのようなハロゲン類、ペルオキソー硫酸、OXONE（登録商標）、過酸化水素等であり、好適には、OXONE（登録商標）等である。

- 10 反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、0℃～100℃（好適には、10℃～50℃）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間（好適には、30分間～15時間）である。

第A10工程は、化合物（145）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（144）に塩基を反応させることにより得られる化合物（144）の塩を、不活性溶媒中、化合物（134）と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A3工程と同様に行われる。

また、化合物（144）の11位の水酸基が $\alpha$ 配置である化合物が市販されており、これを化合物（144）の代わりに用いることにより、化合物（7）のX<sup>1</sup>が $\alpha$ 配置である化合物を得ることができる。

- 20 第A11工程は、化合物（146）を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物（145）と化合物（135）を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A4工程と同様に行われる。

第A12工程は、化合物（147）を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物（146）と還元剤を反応させることにより達成される。

- 25 使用される不活性溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定されないが、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、メタノール、エタノールのようなアルコール系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ピリジン、トリエチルアミンのようなアミン類であり、好適にはメタノール、エ

タノールのようなアルコール系溶媒であり、さらに好適にはメタノール等である。使用される還元剤は、例えば、水素化アルミニウムリチウム、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム、水素化トリ-*t*-ブトキシアルミニウムリチウム、水素化アルミニウムリチウム-トリクロロアルミニウム（アラン）、水素化アルミニウムリチウム-三フッ化ホウ素、水素化アルミニウム塩化マグネシウム、水素化アルミニウムマグネシウム、水素化アルミニウムナトリウム、水素化トリエトキシアルミニウムナトリウム、水素化ビス（メトキシエトキシ）アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム-パラジウム／炭素、硫化水素化ホウ素ナトリウム、シアン化水素化ホウ素ナトリウム、水素化トリメトキシホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、シアン化水素化ホウ素リチウム、水素化トリエチルホウ素リチウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素リチウム、水素化トリ-*t*-ブチルホウ素リチウム、水素化ホウ素カルシウム、水素化ホウ素カリウム、水素化トリイソプロポキシホウ素カリウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素カリウム、水素化ホウ素亜鉛、水素化ホウ素テトラメチルアンモニウム、水素化シアノホウ素テトラ-*n*-ブチルアンモニウムのような金属水素錯化合物、水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化トリフェニルスズ、水素化トリ-*n*-ブチルスズ、水素化ジフェニルスズ、水素化ジ-*n*-ブチルスズ、水素化トリエチルスズ、水素化トリメチルスズ、トリクロシラン／トリ-*n*-ブチルアミン、トリクロシラン／トリ-*n*-プロピルアミン、トリエチルシラン、トリメチルシラン、ジフェニルシラン、フェニルシラン、ポリメチルヒドロシロキサン、ジメチルフェニルシラン、ジ-*n*-ブチルシラン、メチルフェニルシランのような金属水素化物、ジボラン、ジメチルアミン-ボラン、トリメチルアミン-ボラン、エチレンジアミン-ボラン、ピリジン-ボラン、ジメチルスルフィド-ボラン、2, 3-ジメチル-2-ブチルボラン(*thexylborane*)、ビス-3-メチル-2-ブチルボラン(*disiamylborane*)、ジイソピノカンフェニルボラン、ジシクロヘキシルボラン、9-ボラビシクロ[3, 3, 1]ノナン(9-BBN)のようなボラン誘導体であり、好適には水素化アルミニウムリチウム、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム、水素化トリ-*t*-ブトキシアルミニウムリチウム、水素化アルミニウムリチウム-トリクロロアルミニウム（アラン）、水素化

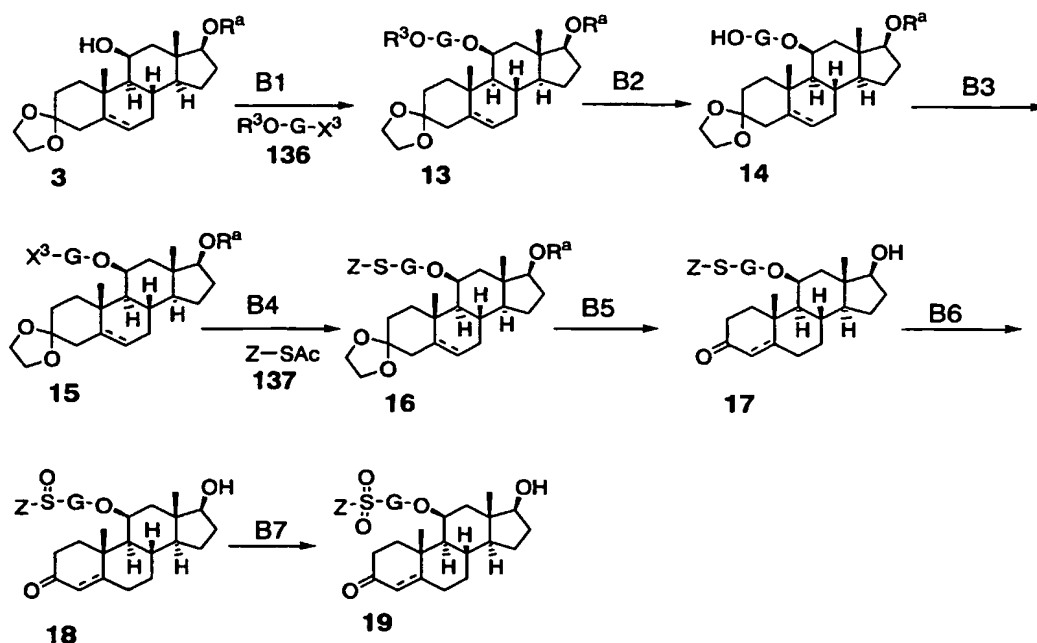
アルミニウムリチウム-三フッ化ホウ素、水素化アルミニウム塩化マグネシウム、水素化アルミニウムマグネシウム、水素化アルミニウムナトリウム、水素化トリエトキシアルミニウムナトリウム、水素化ビス（メトキシエトキシ）アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム-パラジウム／炭素、硫化水素化ホウ素ナトリウム、シアン化水素化ホウ素ナトリウム、水素化トリメトキシホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、シアン化水素化ホウ素リチウム、水素化トリエチルホウ素リチウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素リチウム、水素化トリ-*t*-ブチルホウ素リチウム、水素化ホウ素カルシウム、水素化ホウ素カリウム、水素化トリイソプロポキシホウ素カリウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素カリウム、水素化ホウ素亜鉛、水素化ホウ素テトラメチルアンモニウム、水素化シアノホウ素テトラ-*n*-ブチルアンモニウムのような金属水素錯化合物であり、さらに好適には水素化ホウ素ナトリウムである。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $-30^{\circ}\text{C}$ ～ $100^{\circ}\text{C}$ であり、好適には $0^{\circ}\text{C}$ ～ $70^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分間～48時間であり、好適には30分間～24時間である。

第A13工程は、化合物（7）を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行なわれる。

B法は、一般式（I）で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式（I I）で表される基であり、かつその一般式（I I）で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-G-S-Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物（17）、一般式（I）で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式（I I）で表される基であり、かつその一般式（I I）で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-G-S(O)-Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物（18）、並びに一般式（I）で表される化合物

のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-G-S(O)_2-Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^2$ が水素原子であり、 $R^3$ 及び  $R^4$ は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒になって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (19) を製造する方法

### B 法



第 B 1 工程は、化合物 (13) を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物 (3) に塩基を反応させることにより得られる化合物 (3) の塩を、不活性溶媒中、化合物 (136) と反応させることにより達成され、本反応は、前記 A 法第 A 3 工程と同様に行われる。

第 B 2 工程は、化合物 (14) を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物 (13) と脱保護剤を反応させること、すなわち置換シリル基を除去することにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応を阻害しないものであれば、特に限定されないが、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンの

ようなエーテル系溶媒、ジメチルホルムアミド、水であり、好適には、テトラヒドロフラン等である。使用される脱保護剤は、特に限定されないが、例えば、フッ化水素、フッ化水素-ピリジン、フッ化ナトリウム、フッ化カリウム、フッ化テトラ-*n*-ブチルアンモニウムのようなフッ化物、蟻酸、酢酸、*p*-トルエン  
5 スルホン酸のような有機酸であり、好ましくは、フッ化テトラ-*n*-ブチルアンモニウム等である。

反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、0℃～80℃（好適には、0℃～50℃）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間（好適には、30分間～15時間）である。

10 第B3工程は、化合物（15）を製造する工程で、アミン系溶媒中、化合物（14）を塩化スルホニル化合物と反応させるか、あるいは、不活性溶媒中、化合物（14）をハロゲン化剤と反応させることにより、達成される。

使用されるアミン系溶媒は、特に限定されないが、例えば、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-  
15 ウンデセン、ピリジン等であり、好適には、ピリジン、トリエチルアミン等である。

使用される塩化スルホニル化合物は、特に限定されないが、例えば、*p*-トル  
エン  
スルホニルクロリド、ベンゼンスルホニルクロリド、メタンスルホニルクロリド、トリフルオロメタンスルホニルクロリド等であり、好適には、メタンスル  
20 ホニルクロリド、トリフルオロメタンスルホニルクロリド等である。

使用される不活性溶媒は、本反応に関与しないものであれば特に限定しないが、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのよ  
うなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、アセトニトリルのようなニトリル系溶媒、ジクロロメ  
25 タン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、*N*-メチルピロリドン、酢酸エチル等であり得、好適にはベンゼン、ジクロロメタン等である。

使用されるハロゲン化剤は、例えば、四塩化炭素-トリフェニルホスフィン、



塩化チオニル、塩化スルフリル、N-クロロコハク酸イミド-トリフェニルホスフィン、N-クロロコハク酸イミド-ジメチルスルフィド、三塩化リン、五塩化リン等のクロロ化剤、又は四臭化炭素-トリフェニルホスフィン、N-ブロモコハク酸イミド-トリフェニルホスフィン、N-ブロモコハク酸イミド-ジメチルスルフィド、三臭化リン、五臭化リン等のプロモ化剤であり得、好適には四臭化炭素-トリフェニルホスフィン、塩化チオニル等である。反応温度は、通常、0℃～80℃であり、好適には10℃～40℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、10分間～10時間であり、好適には30分間～3時間である。

- 10 第B4工程は、化合物(16)を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物(137)と金属アルコキシドを反応させることにより得られる化合物(137)の反応性誘導体を、アルコール系溶媒中、化合物(15)と反応させることにより達成される。

- 15 使用されるアルコール系溶媒は、特に限定されないが、例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、i-プロパノール又はこれらの混合溶媒であり得、好適には、メタノール、メタノール-テトラヒドロフラン混合溶媒等である。

- 20 使用される金属アルコキシドは、特に限定されないが、例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等であり、好適には、ナトリウムメトキシド等である。

反応温度は、溶媒等の条件により異なるが、通常、0℃～80℃であり、好適には10℃～40℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、10分間～10時間であり、好適には30分間～8時間である。

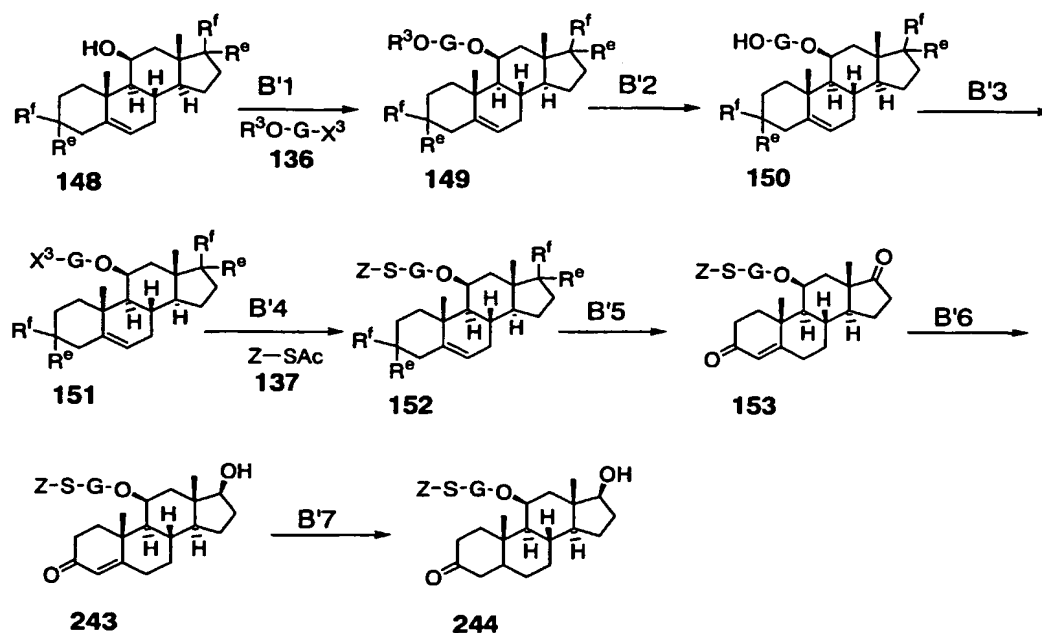
- 25 第B5工程は、化合物(17)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(16)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A5工程と同様に行われる。

第B6工程は、化合物(18)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(17)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる。

第B7工程は、化合物(19)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(18)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

B'法は、化合物(17)の、破線が実線と共に二重結合である化合物(243)、及び化合物(17)の、破線が実線と共に単結合である化合物(244)を製造する別の方法である。

### B'法



第B'1工程は、化合物(149)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(148)に塩基を反応させることにより得られる化合物(148)の塩を、不活性溶媒中、化合物(136)と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A3工程と同様に行われる。

第B'2工程は、化合物(150)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(149)と脱保護剤を反応させること、すなわち置換シリル基を除去することにより達成され、本反応は、前記B法第B2工程と同様に行われる。

第B'3工程は、化合物(151)を製造する工程で、アミン系溶媒中、化合物(150)を塩化スルホニル化合物と反応させるか、あるいは、不活性溶媒中

、化合物（１５０）をハロゲン化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記Ｂ法第Ｂ３工程と同様に行われる。

第Ｂ'４工程は、化合物（１５２）を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物（１３７）と金属アルコキシドを反応させることにより得られる化合物（  
5 １３７）の反応性誘導体を、アルコール系溶媒中、化合物（１５１）と反応させることにより達成され、本反応は、前記Ｂ法第Ｂ４工程と同様に行われる。

第Ｂ'５工程は、化合物（１５３）を製造する工程で、水系溶媒中、化合物（１５２）を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記Ａ法第Ａ５工程と同様に行われる。

10 第Ｂ'６工程は、化合物（２４３）を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物（１５３）と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記Ａ法第Ａ１２工程と同様に行われる。

第Ｂ'７工程は、化合物（２４４）を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、化合物（２４３）の接触還元を行なうか、又は、混合されて  
15 いてもよい不活性溶媒中、化合物（２４３）と還元剤を反応させることにより達成される。

接触還元を行なう場合に使用される溶媒は、メタノール、エタノール、ｎ－プロパノール、  
i－プロパノール、ｎ－ブタノール、s－ブタノール、t－ブタノール、ペンタノール、ヘキサノール、シクロプロパノール、シクロブタノール、  
20 シクロペンタノール、シクロヘキサノール、エチレングルコール、１，３－プロパンジオール、１，４－ブタンジオール、１，５－ペンタンジオールのようなアルコール系溶媒、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素の  
25 ようなハロゲン系溶媒、ピリジン、トリエチルアミンのようなアミン系溶媒、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、N－メチルピロリドン、酢酸エチル、アセトニトリル、ニトロメタンであり得、好適には、エタノール、エーテル、ジオキサン、ピリジン等である。

接触還元を用いる条件は、水素-クロロトリス（トリフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-クロロトリス（トリパラトリルホスフィン）ロジウム（I）、水素-クロロトリス（トリパラメトキシフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-ヒドリドカルボニルトリス（トリフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-酢酸ロジウム（II）、水素-酢酸ルテニウム（II）、水素-クロロヒドリドトリス（トリフェニルホスフィン）ルテニウム（II）、水素-カルボキシラトヒドリドトリス（トリフェニルホスフィン）ルテニウム（II）、水素-ヒドリドカルボニルトリス（トリフェニルホスフィン）イリジウム（I）、水素-白金（II）-塩化スズ錯体、水素-ペンタシアノコバルト（II）錯体、水素-トリシアノビピリジンコバルト（II）錯体、水素-ビス（ジメチルグリオキシマト）コバルト（II）錯体、水素-安息香酸メチル-トリカルボニルクロム錯体、水素-ビス（トリカルボニルシクロペンタジエニルクロム）、水素-ペンタカルボニル鉄、水素-ビス（シクロペンタジエニル）ジカルボニルチタン、水素-ヒドリドカルボニルコバルト錯体、水素-オクタカルボニルニコバルト、水素-ヒドリドカルボニルロジウム、水素-クロム（III）アセチルアセトナート-トリイソブチルアルミニウム、水素-コバルト（II）アセチルアセトナート-トリイソブチルアルミニウム、水素-ニッケル（II）-2-ヘキサノアート-トリエチルアルミニウム等の均一系、水素-二酸化白金、水素-白金/炭素、水素-パラジウム/炭素、水素-パラジウム/硫酸バリウム、水素-パラジウム/炭酸カルシウム、水素-ラネ-ニッケル、水素-カッパークロマイト、水素-ロジウム/炭素、水素-ロジウム/アルミナ、水素-二酸化ルテニウム、水素-ルテニウム/炭素等の不均一系条件であり得、好ましくは水素-クロロトリス（トリフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-パラジウム/炭素、水素-パラジウム/炭酸カルシウム等である。

反応温度は、通常0℃～100℃であり、好適には0℃～60℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、10分間～24時間であり、好適には10分間～6時間である。

還元剤と反応させる場合に使用される不活性溶媒は、反応に関与しないものであれば特に限定されないが、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサ

ン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、ピリジン、トリエチルアミンのようなアミン系溶媒、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、アセトニトリル、ニトロメタンであり得、好適には、テトラヒドロフラン、ベンゼン、トルエン、ピリジン等である。

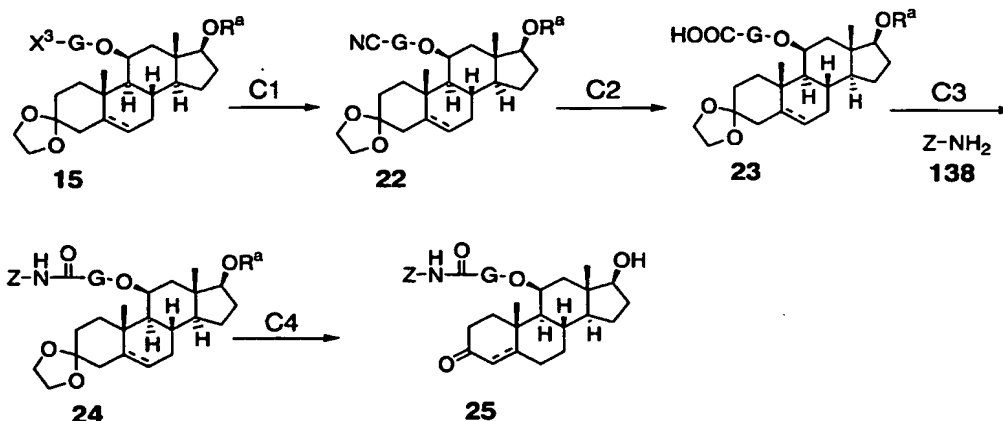
使用される還元剤は、例えば、ナトリウム／液体アンモニア、リチウム／液体アンモニア、リチウム／メチルアミン、リチウム／エチルアミン、リチウム／エチレンジアミン、ナトリウム／ヘキサメチルホスホアミド-*t*-ブタノール、ナトリウム／エタノール、ナトリウム／*t*-ブタノール-テトラヒドロフラン、ナトリウム／トルエン-*t*-アミルアルコールのような金属、水素化トリフェニルスズ、水素化トリ-*n*-ブチルスズ、水素化ジフェニルスズ、水素化ジ-*n*-ブチルスズ、水素化トリエチルスズ、水素化トリメチルスズ、トリクロシラン／トリ-*n*-ブチルアミン、トリクロシラン／トリ-*n*-プロピルアミン、トリエチルシラン、トリメチルシラン、ジフェニルシラン、フェニルシラン、ポリメチルヒドロシロキサン、ジメチルフェニルシラン、ジ-*n*-ブチルシラン、メチルフェニルシランのような金属水素化物、水素化アルミニウムリチウム／ヨウ化銅（I）、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム／臭化銅（I）、水素化トリ-*t*-ブトキシアルミニウムリチウム／臭化銅（I）、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム-パラジウム／炭素、硫化水素化ホウ素ナトリウム、シアン化水素化ホウ素ナトリウム、水素化トリメトキシホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、シアン化水素化ホウ素リチウム、水素化トリエチルホウ素リチウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素リチウム、水素化トリ-*t*-ブチルホウ素リチウム、水素化ホウ素カルシウム、水素化ホウ素カリウム、水素化トリイソプロポキシホウ素カリウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素カリウム、水素化ホウ素亜鉛、水素化ホウ素テトラメチルアンモニウム、水素化シアノホウ素テトラ-*n*-ブチルアンモニウムのような金属水素錯化合物等であり、好適には、ナトリウム／液体アンモニア、リチウム／液体アンモニア、水素化トリフェニルスズ

、水素化トリ-*n*-ブチルスズ、水素化アルミニウムリチウム／ヨウ化銅（I）、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム／臭化銅（I）、水素化ホウ素ナトリウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素カリウム等である。

5 反応温度は、還元剤の種類により異なるが、通常-80℃～100℃であり、好適には-78℃～80℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、10分間～24時間であり、好適には10分間～6時間である。

C法は、一般式（I）で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式（II）で表される基であり、かつその一般式（II）で表される基のうち、A<sub>r</sub>が単結合であり、Aが-O-であり、R<sup>1</sup>が-G-CONH-Zであり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物（25）を製造する方法である。

### C法



第C1工程は、化合物（22）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（15）をシアノ化剤と反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しないものであれば特に限定されないが、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼン  
20 のような芳香族系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハ

ロゲン系溶媒、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、酢酸エチル、アセトニトリル、ニトロメタン等であり得、好適にはジメチルスルホキシド等である。

- 5      使用されるシアノ化剤は、例えば、シアニ化リチウム、シアニ化ナトリウム、シアニ化カリウム等であり得、好適にはシアニ化ナトリウム等である。

反応温度は、通常、0℃～80℃であり、好適には10℃～40℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、10分間～24時間であり、好適には1時間～15時間である。

- 10     第C2工程は、化合物(23)を製造する工程で、化合物(22)を塩基の存在下加水分解することにより達成される。

使用される溶媒は、通常の加水分解反応に使用されるものであれば特に限定はなく、メタノール、エタノールのようなアルコール系溶媒、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル系溶媒、水、あるいはこれらの混合溶媒であり得、  
15     好適には水又は水-エタノール等の含水アルコール系溶媒である。

使用される塩基は、化合物の他の部分に影響を与えないものであれば特に限定されないが、好適には、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化バリウム、水酸化セシウムのような金属水酸化物であり、特に好適には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等である。

- 20     反応温度は、通常、0℃～100℃であり、好適には50℃～100℃である。

反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、10分間～48時間であり、好適には5時間～48時間である。

- 25     第C3工程は、化合物(24)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(23)又はその反応性誘導体(酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類)と、化合物(138)又はその酸付加塩を反応させることにより達成される。

本反応は、例えば、酸ハライド法、混合酸無水物法、活性エステル法又は縮合法によって行われる。酸ハライド法は、不活性溶媒中、化合物(23)をハロゲン化剤(例えば、チオニルクロリド、シュウ酸クロリド、五塩化リン等)と反応

させ、酸ハライドを製造し、その酸ハライドと化合物（１３８）又はその酸付加塩を不活性溶媒中、塩基の存在下又は非存在下（好適には、存在下）、反応させることにより達成される。使用される塩基は、例えば、トリエチルアミン、*N*-メチルモルホリン、ピリジン、４-ジメチルアミノピリジンのような有機アミン類、重曹、重炭酸カリウムのようなアルカリ金属重炭酸塩、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩であり得、好適には、有機アミン類（特に好適には、トリエチルアミン）である。

使用される溶媒は、反応に関与しなければ、特に限定されないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素系溶媒、ジクロルメタン、１，２-ジクロルエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化系溶媒、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル系溶媒、アセトンのようなケトン系溶媒、*N*，*N*-ジメチルアセタミド、*N*，*N*-ジメチルホルムアミド、*N*-メチル-２-ピロリドンのようなアミド系溶媒、ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド系溶媒であり得、好適には、炭化水素系溶媒、ハロゲン化系溶媒又はエーテル系溶媒であり、更に好適には、エーテル系溶媒（特に好適には、テトラヒドロフラン）である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、ハロゲン化剤と化合物（２３）との反応及び酸ハライドと化合物（１３８）又はその酸付加塩との反応とも、通常－２０℃～１５０℃であり、好適には、ハロゲン化剤と化合物（２３）との反応は－１０℃～５０℃であり、酸ハライドと化合物（１３８）又はその酸付加塩との反応は０℃～１００℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常１５分間～２４時間（好適には、３０分間～１５時間）である。

混合酸無水物法は、ハロゲノ炭酸  $C_1-C_6$  アルキル（ここで、 $C_1-C_6$  アルキルは、炭素数１～６の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を意味する）、 $C_1-C_6$  アルキルシアノリン酸又はジアリールホスホリルアジドと化合物（２３）を反応させ、混合酸無水物を製造し、その混合酸無水物と化合物（１３８）又はその酸付加塩を反応させることにより達成される。混合酸無水物を製造する反応は、クロル炭酸メチル、クロル炭酸エチル、クロル炭酸イソブチル、クロル炭酸ヘキシルのようなハロゲノ炭酸  $C_1-C_6$  アルキル（好適には、クロル炭



酸エチル又はクロル炭酸イソブチル)、ジメチルシアノリン酸、ジエチルシアノリン酸、ジヘキシルシアノリン酸のようなジ-C1-C6アルキルシアノリン酸又はジフェニルリン酸アジド、ジ-(p-ニトロフェニル)リン酸アジド、ジナフチルリン酸アジドのようなジアリールリン酸アジド(好適には、ジフェニルリン酸アジド)と化合物(23)を反応させることにより行われ、好適には、不活性溶媒中、塩基の存在下に行われる。

使用される塩基及び不活性溶媒は、本工程の酸ハライド法で使用されるものと同様である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、-20℃~50℃(好適には、0℃~30℃)である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、15分間~24時間(好適には、30分間~15時間)である。

混合酸無水物と化合物(138)又はその酸付加塩との反応は、不活性溶媒中、塩基の存在下又は非存在下(好適には、存在下)で行われ、使用される塩基及び不活性溶媒は、上記の酸ハライド法で使用されるものと同様である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、-20℃~50℃(好適には、0℃~30℃)である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、15分間~24時間(好適には、30分間~15時間)である。また、本方法において、ジ-C1-C6アルキルシアノリン酸又はジアリールリン酸アジドを使用する場合には、塩基の存在下、化合物(23)と化合物(138)又はその酸付加塩を直接反応させることもできる。

20 活性エステル化法は、縮合剤(例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール等)の存在下、化合物(23)を活性エステル化剤(例えば、N-ヒドロキシサクシンイミド、N-ヒドロキシベンゾトリアゾールのようなN-ヒドロキシ化合物等)と反応させ、活性エステルを製造し、この活性エステルと化合物(138)又はその酸付加塩を反応させることにより、達成される。活性エステルを製造する反応は、好適には、不活性溶媒中で行われ、使用される不活性溶媒は、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、ジメチルホルムアミド、酢酸エチル、アセトニトリル等であり得、好適にはジクロロメタン、アセトニトリル、酢酸エチル等であ

る。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、活性エステル化反応では、通常、 $-20^{\circ}\text{C} \sim 50^{\circ}\text{C}$ （好適には、 $-10^{\circ}\text{C} \sim 30^{\circ}\text{C}$ ）であり、活性エステル化合物と化合物（138）又はその酸付加塩との反応では、 $-20^{\circ}\text{C} \sim 50^{\circ}\text{C}$ （好適には、 $-10^{\circ}\text{C} \sim 30^{\circ}\text{C}$ ）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、両

5 反応共、通常15分間～24時間（好適には、30分間～15時間）である。

縮合法は、縮合剤〔例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール、1-（N，N-ジメチルアミノプロピル）-3-エチルカルボジイミド塩酸塩等〕の存在下、化合物（23）と化合物（138）又はその酸付加塩を直接反応させることにより行われる。本反応は、前記の活性エステルを製造

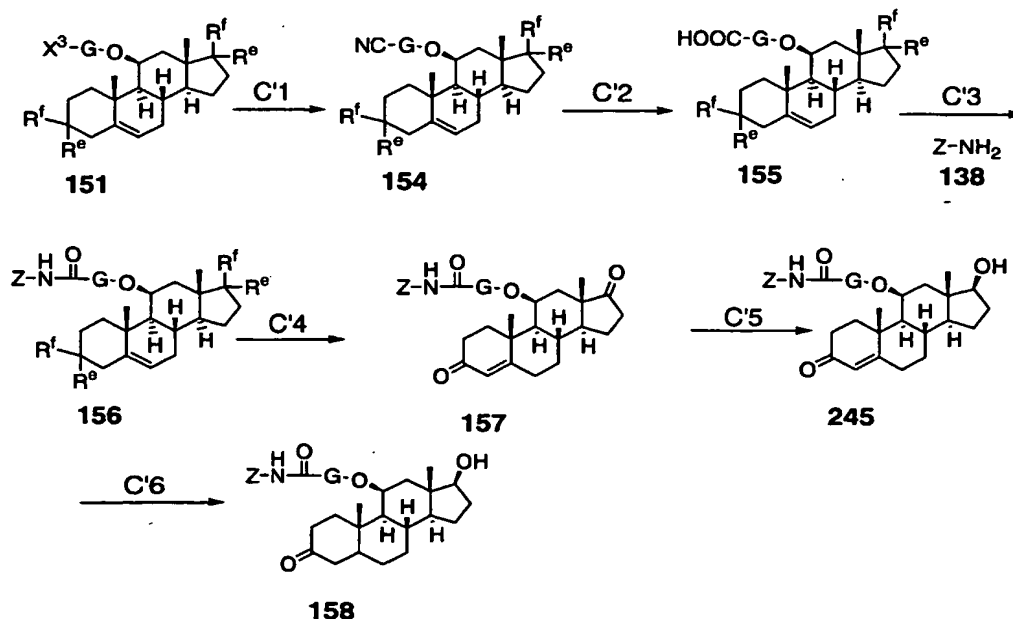
10 する反応と同様に行われる。

第C4工程は、化合物（25）を製造する工程で、水系溶媒中、化合物（24）を酸と反応させるとこにより達成され、本反応は、前記A法第A5工程と同様に行われる。

C'法は、化合物（25）の、破線が実線と共に二重結合である化合物（24

15 5）及び、化合物（25）の、破線が実線と共に単結合である化合物（158）を製造する方法である。

### C'法



第C' 1工程は、化合物(154)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(151)をシアノ化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C 1工程と同様に行われる。

- 5 第C' 2工程は、化合物(155)を製造する工程で、化合物(154)を塩基の存在下加水分解することにより達成され、本反応は、前記C法第C 2工程と同様に行われる。

- 第C' 3工程は、化合物(156)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(155)又はその反応性誘導体(酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類)と、化合物(138)又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C 3工程と同様に行われる。

第C' 4工程は、化合物(157)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(156)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A 5工程と同様に行われる。

- 15 第C' 5工程は、化合物(245)を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(157)と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A 1 2工程と同様に行われる。

- 第C' 6工程は、化合物(158)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、化合物(245)の接触還元を行なうか、又は、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(245)と還元剤を反応させることにより達成される。

- 接触還元を行なう場合に使用される溶媒は、メタノール、エタノール、n-プロパノール、i-プロパノール、n-ブタノール、s-ブタノール、t-ブタノール、ペンタノール、ヘキサノール、シクロプロパノール、シクロブタノール、シクロペンタノール、シクロヘキサノール、エチレングルコール、1, 3-プロパンジオール、1, 4-ブタンジオール、1, 5-ペンタンジオールのようなアルコール系溶媒、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素の

ようなハロゲン系溶媒、ピリジン、トリエチルアミンのようなアミン系溶媒、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、酢酸エチル、アセトニトリル、ニトロメタンであり得、好適には、エタノール、エーテル、ジオキサン、ピリジン等である。

接触還元を用いる条件は、水素-クロロトリス（トリフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-クロロトリス（トリパラトリルホスフィン）ロジウム（I）、水素-クロロトリス（トリパラメトキシフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-ヒドリドカルボニルトリス（トリフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-酢酸ロジウム（II）、水素-酢酸ルテニウム（II）、水素-クロロヒドリドトリス（トリフェニルホスフィン）ルテニウム（II）、水素-カルボキシラトヒドリドトリス（トリフェニルホスフィン）ルテニウム（II）、水素-ヒドリドカルボニルトリス（トリフェニルホスフィン）イリジウム（I）、水素-白金（II）-塩化スズ錯体、水素-ペンタシアノコバルト（II）錯体、水素-トリシアノビピリジンコバルト（II）錯体、水素-ビス（ジメチルグリオキシマト）コバルト（II）錯体、水素-安息香酸メチル-トリカルボニルクロム錯体、水素-ビス（トリカルボニルシクロペンタジエニルクロム）、水素-ペンタカルボニル鉄、水素-ビス（シクロペンタジエニル）ジカルボニルチタン、水素-ヒドリドカルボニルコバルト錯体、水素-オクタカルボニルニコバルト、水素-ヒドリドカルボニルロジウム、水素-クロム（III）アセチルアセトナート-トリイソブチルアルミニウム、水素-コバルト（II）アセチルアセトナート-トリイソブチルアルミニウム、水素-ニッケル（II）-2-ヘキサノアート-トリエチルアルミニウム等の均一系、水素-二酸化白金、水素-白金/炭素、水素-パラジウム/炭素、水素-パラジウム/硫酸バリウム、水素-パラジウム/炭酸カルシウム、水素-ラネ-ニッケル、水素-カッパークロマイト、水素-ロジウム/炭素、水素-ロジウム/アルミナ、水素-二酸化ルテニウム、水素-ルテニウム/炭素等の不均一系条件であり得、好ましくは水素-クロロトリス（トリフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-パラジウム/炭素、水素-パラジウム/炭酸カルシウム等である。

反応温度は、通常0℃～100℃であり、好適には0℃～60℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、10分間～24時間であり、好適には10分間～6時間である。

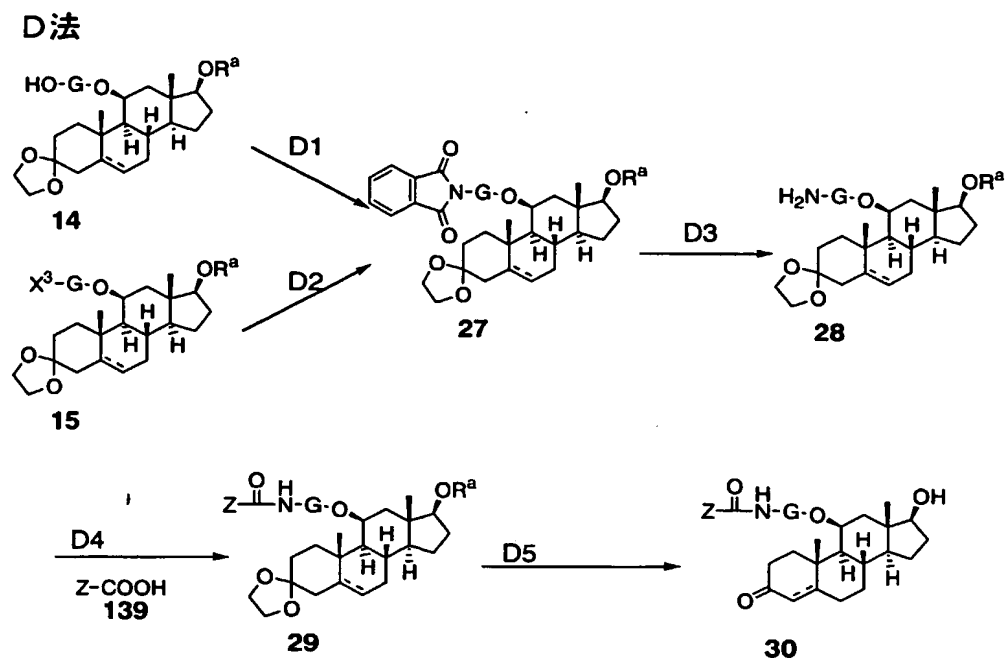
還元剤と反応させる場合に使用される不活性溶媒は、反応に関与しないものであれば特に限定されないが、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、ピリジン、トリエチルアミンのようなアミン系溶媒、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、アセトニトリル、ニトロメタンであり得、好適には、テトラヒドロフラン、ベンゼン、トルエン、ピリジン等である。

使用される還元剤は、例えば、ナトリウム/液体アンモニア、リチウム/液体アンモニア、リチウム/メチルアミン、リチウム/エチルアミン、リチウム/エチレンジアミン、ナトリウム/ヘキサメチルホスホアミド-*t*-ブタノール、ナトリウム/エタノール、ナトリウム/*t*-ブタノール-テトラヒドロフラン、ナトリウム/トルエン-*t*-アミルアルコールのような金属、水素化トリフェニルスズ、水素化トリ-*n*-ブチルスズ、水素化ジフェニルスズ、水素化ジ-*n*-ブチルスズ、水素化トリエチルスズ、水素化トリメチルスズ、トリクロシラン/トリ-*n*-ブチルアミン、トリクロシラン/トリ-*n*-プロピルアミン、トリエチルシラン、トリメチルシラン、ジフェニルシラン、フェニルシラン、ポリメチルヒドロシロキサン、ジメチルフェニルシラン、ジ-*n*-ブチルシラン、メチルフェニルシランのような金属水素化物、水素化アルミニウムリチウム/ヨウ化銅(I)、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム/臭化銅(I)、水素化トリ-*t*-ブトキシアルミニウムリチウム/臭化銅(I)、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム-パラジウム/炭素、硫化水素化ホウ素ナトリウム、シアン化水素化ホウ素ナトリウム、水素化トリメトキシホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、シアン化水素化ホウ素リチウム、水素化トリエチルホウ素リチウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素リチウム、水素化トリ-*t*-ブチルホウ

素リチウム、水素化ホウ素カルシウム、水素化ホウ素カリウム、水素化トリイソ  
 プロポキシホウ素カリウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素カリウム、水素化ホ  
 ウ素亜鉛、水素化ホウ素テトラメチルアンモニウム、水素化シアノホウ素テトラ  
 -*n*-ブチルアンモニウムのような金属水素錯化合物等であり、好適には、ナト  
 5 リウム／液体アンモニア、リチウム／液体アンモニア、水素化トリフェニルスズ  
 、水素化トリ-*n*-ブチルスズ、水素化アルミニウムリチウム／ヨウ化銅（I）  
 、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム／臭化銅（I）、水素化ホウ素ナト  
 リウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素カリウム等である。

反応温度は、還元剤の種類により異なるが、通常-80℃～100℃であり、  
 10 好適には-78℃～80℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通  
 常、10分間～24時間であり、好適には10分間～6時間である。

D法は、一般式（I）で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式（I  
 I）で表される基であり、かつその一般式（I I）で表される基のうち、A<sub>r</sub>が  
 単結合であり、Aが-O-であり、R<sup>1</sup>が-G-NHCO-Zであり、X<sup>2</sup>が水素  
 15 原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の  
 炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二  
 重結合である化合物（30）を製造する方法である。



第D 1工程は、化合物（2 7）を製造する工程で、不活性溶媒中、アゾジカルボン酸ジアルキルエステル（好適には、アゾジカルボン酸ジエチル）及びホスフィン化合物（好適には、トリフェニルホスフィン）の存在下、化合物（1 4）を

使用される不活性溶媒は、反応に関与しないものであれば、特に限定されないが、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒であり、好適には、テトラヒドロフラン等である。

反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、0℃～5 0℃（好適には、1 0℃～3 0℃）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常1 5分間～4 8時間（好適には、3 0分間～2 4時間）である。

第D 2工程は、化合物（2 7）を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物（1 5）をフタルイミドの金属塩（好適には、フタルイミドカリウム）と反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しないものであれば、特に限定されないが、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンの

5 ようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ジクロロメタンのようなハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等であり、好適には、テトラヒドロフラン等である。

反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、0℃～50℃（好適には、10℃～30℃）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～48時間（好適には、30分間～24時間）である。

10 第D3工程は、化合物（28）を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物（27）を、アミン系化合物（好適には、ヒドラジン）と反応させることにより達成される。

使用されるアルコール系溶媒は、反応を阻害しないものであれば、特に限定されないが、例えば、メタノール、エタノール、n-プロピルアルコール、i-プロピルアルコール等であり、好適には、エタノール等である。

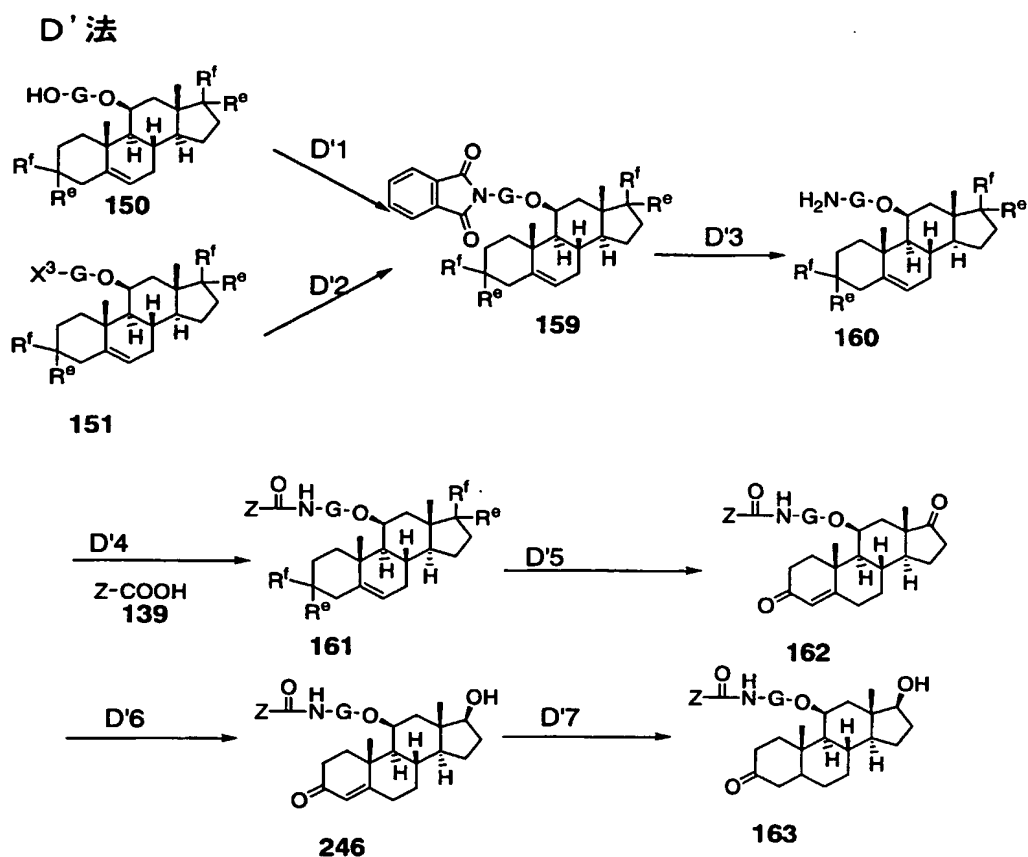
15 反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、0℃～50℃（好適には、10℃～30℃）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～48時間（好適には、30分間～24時間）である。

第D4工程は、化合物（29）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（139）又はその反応性誘導体（酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類）と、化合物（28）又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C3工程と同様に行われる。

第D5工程は、化合物（30）を製造する工程で、水系溶媒中、化合物（29）を酸と反応させるとこにより達成され、本反応は、前記A法第A5工程と同様に行われる。

25 D'法は、化合物（30）の、破線が実線と共に二重結合である化合物（246）及び、化合物（30）の、破線が実線と共に単結合である化合物（163）を製造する方法である。





第D' 1工程は、化合物（159）を製造する工程で、不活性溶媒中、アゾジカルボン酸ジアルキルエステル（好適には、アゾジカルボン酸ジエチル）及びホスフィン化合物（好適には、トリフェニルホスフィン）の存在下、化合物（150）をフタルイミドと反応させることにより達成され、本反応は、前記D法第D1工程と同様に行われる。

第D' 2工程は、化合物（159）を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物（151）をフタルイミドの金属塩（好適には、フタルイミドカリウム）と反応させることにより達成され、本反応は、前記D法第D2工程と同様に行われる。

第D' 3工程は、化合物（160）を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物（159）を、アミン系化合物（好適には、ヒドラジン）と反応させることにより達成され、本反応は、前記D法第D3工程と同様に行われる。

第D' 4工程は、化合物（161）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（139）又はその反応性誘導体（酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステ

ル類)と、化合物(160)又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記D法第D4工程と同様に行われる。

第D'5工程は、化合物(162)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(161)を酸と反応させるとこにより達成され、本反応は、前記C法第C4工程と同様に行われる。

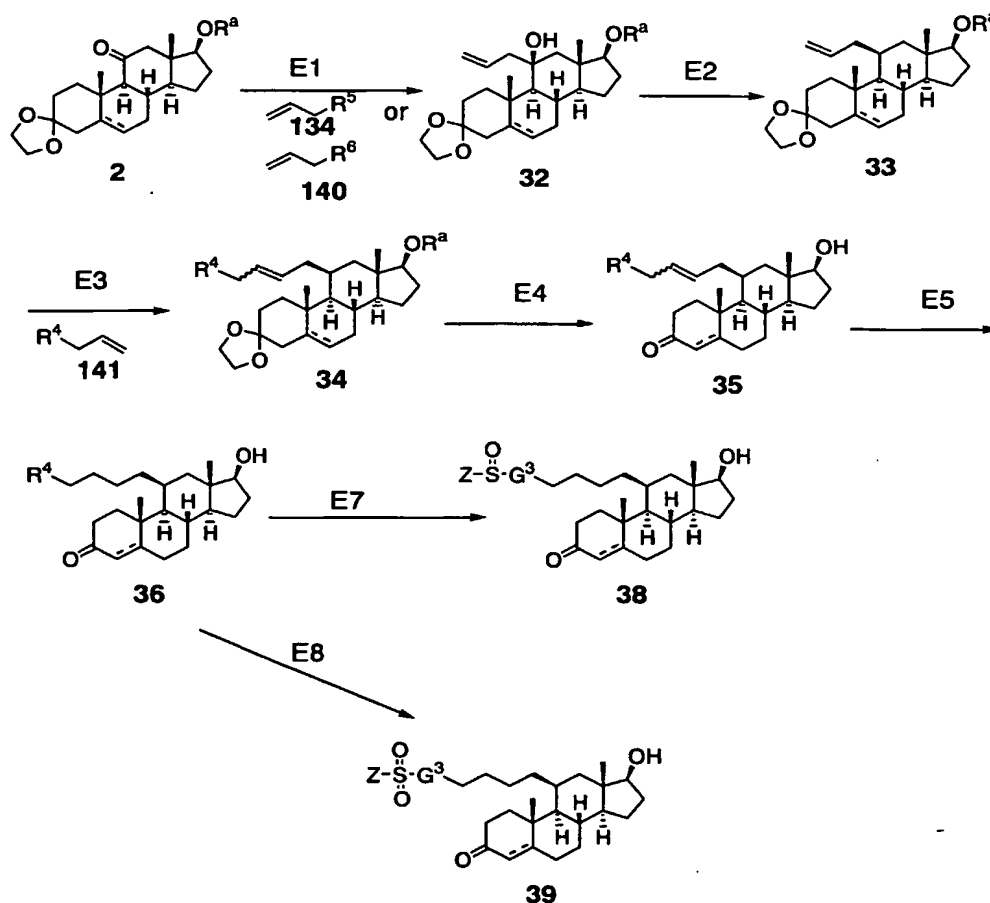
第D'6工程は、化合物(246)を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(162)と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A12工程と同様に行われる。

第D'7工程は、化合物(163)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、化合物(246)の接触還元を行なうか、又は、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(246)と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記C'法第C'6工程と同様に行われる。

E法は、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が $-CH=CH-CH_2-R^4$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(35)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_3-R^4$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(36)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_3-G^3-S(O)-Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(38)、並びに一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、

一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、Ar が単結合であり、A がメチレン基であり、R<sup>1</sup> が  $-(CH_2)_3-G^3-S(O)_2-Z$  であり、X<sup>2</sup> が水素原子であり、R<sup>2</sup> が水素原子であり、R<sup>b</sup> 及び R<sup>c</sup> は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒に  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (39) を製造する方法である。

## E 法



第 E 1 工程は、化合物 (32) を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物 (134) と金属 (好適には、マグネシウム) 又はアルキルリチウム (好適には、*t*-ブチルリチウム) を反応させることにより得られる化合物 (134) の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物 (2) と反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しなければ、特に限定されないが、好適に

は、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル類であり、更に好ましくは、テトラヒドロフランである。

反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $0^{\circ}\text{C}\sim 80^{\circ}\text{C}$ （好適には、 $10^{\circ}\text{C}\sim 50^{\circ}\text{C}$ ）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分  
5 間～24時間（好適には、30分間～15時間）である。

本工程は、また、不活性溶媒中、活性化剤の存在下、化合物（2）を化合物（140）と反応させることによっても達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しなければ、特に限定されないが、好適には、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのような  
10 エーテル系溶媒、ジクロロメタンのようなハロゲン系溶媒であり、好適には、テトラヒドロフラン、ジクロロメタン等である。

使用される活性化剤は、反応を阻害しないものであれば特に限定されないが、例えば、フッ化テトラ $n$ -ブチルアンモニウムのようなフッ化物、三塩化アルミニウム、二塩化エチルアルミニウム、四塩化チタン、三フッ化ホウ素、トリフルオ  
15 ロメタンスルホン酸トリメチルシリルのようなルイス酸等であり、好適には、トリフルオロメタンスルホン酸トリメチルシリル等である。

反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $-78^{\circ}\text{C}\sim 50^{\circ}\text{C}$ （好適には、 $-60^{\circ}\text{C}\sim 30^{\circ}\text{C}$ ）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間（好適には、30分間～5時間）である。

20 第E2工程は、化合物（33）を製造する工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物（32）を還元剤と反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しなければ特に限定されないが、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、エ  
25 ーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒であり、好ましくはベンゼン、トルエン、ジクロロメタン等である。

使用される添加剤は、反応を阻害しないものであれば特に限定されないが、好ましくは、1,1'-チオカルボニルジイミダゾール、ホスゲン、塩化ベンゾイル、ヨウ化亜鉛、三フッ化ホウ素（ $\text{BF}_3$ ）等である。

使用される還元剤は、例えば、水素化トリフェニルスズ、水素化トリ-*n*-ブチルスズ、水素化ジフェニルスズ、水素化ジ-*n*-ブチルスズ、水素化トリエチルスズ、水素化トリメチルスズ、トリクロシラン／トリ-*n*-ブチルアミン、トリクロシラン／トリ-*n*-プロピルアミン、トリエチルシラン、トリメチルシラン、ジフェニルシラン、フェニルシラン、ポリメチルヒドロシロキサン、ジメチルフェニルシラン、ジ-*n*-ブチルシラン、メチルフェニルシランのような金属水素化物、水素化アルミニウムリチウム、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム、水素化トリ-*t*-ブトキシアルミニウムリチウム、水素化アルミニウムリチウム-トリクロロアルミニウム（アラン）、水素化アルミニウムリチウム-三フッ化ホウ素、水素化アルミニウム塩化マグネシウム、水素化アルミニウムマグネシウム、水素化アルミニウムナトリウム、水素化トリエトキシアルミニウムナトリウム、水素化ビス（メトキシエトキシ）アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム-パラジウム／炭素、硫化水素化ホウ素ナトリウム、シアン化水素化ホウ素ナトリウム、水素化トリメトキシホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、シアン化水素化ホウ素リチウム、水素化トリエチルホウ素リチウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素リチウム、水素化トリ-*t*-ブチルホウ素リチウム、水素化ホウ素カルシウム、水素化ホウ素カリウム、水素化トリイソプロポキシホウ素カリウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素カリウム、水素化ホウ素亜鉛、水素化ホウ素テトラメチルアンモニウム、水素化シアノホウ素テトラ-*n*-ブチルアンモニウムのような金属水素錯化合物であり、好ましくは、水素化トリ-*n*-ブチルスズ、トリエチルシラン、シアン化水素化ホウ素ナトリウム等である。

反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、0℃～150℃（好適には、10℃～100℃）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間（好適には、30分間～15時間）である。

また、この工程で副生する、化合物（33）の11位のアリル基が $\alpha$ 配置である化合物を用いることにより、化合物（35）、化合物（36）、化合物（38）、及び化合物（39）のX'が $\alpha$ 配置である化合物を得ることができる。

第E3工程は、化合物（34）を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触

媒存在下、化合物(33)と化合物(141)を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A4工程と同様に行われる。

第E4工程は、化合物(35)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(34)を酸と反応させるとにより達成され、本反応は、前記A法第A5工程と同様  
5 に行われる。

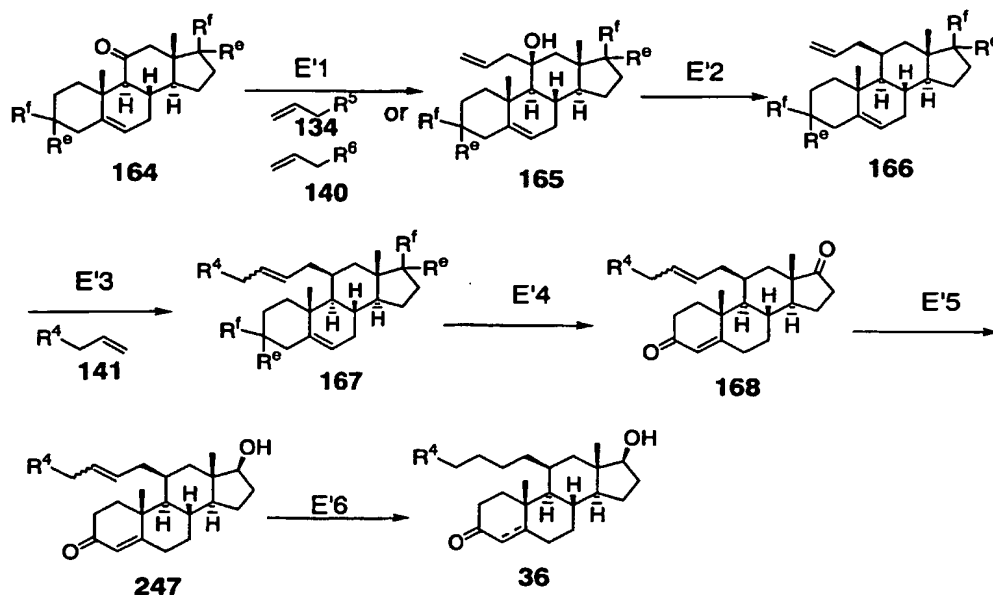
第E5工程は、化合物(36)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行われる。

第E7工程は、化合物(36)のR'におけるQ'が-S-である場合、化合物  
10 (38)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(36)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる。

第E8工程は、化合物(36)のR'におけるQ'が-S-である場合、化合物(39)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(36)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

15 E'法は、化合物(35)の、破線が実線と共に二重結合である化合物(247)及び、化合物(36)の、破線が実線と共に単結合である化合物(248)を製造する別の方法である。

## E' 法



第E' 1工程は、化合物(165)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(134)と金属(好適には、マグネシウム)又はアルキルリチウム(好適には、*t*-ブチルリチウム)を反応させることにより得られる化合物(134)の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物(164)と反応させることにより達成されるか、あるいは、不活性溶媒中、活性化剤の存在下、化合物(164)を化合物(140)と反応させることによっても達成され、本反応は、前記E法第E1工程と同様に行われる。

第E' 2工程は、化合物(166)を製造する工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物(166)を還元剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記E法第E2工程と同様に行われる。

また、この工程で副生する、化合物(166)の11位のアリル基が $\alpha$ 配置である化合物を用いることにより、化合物(35)及び化合物(36)のX'が $\alpha$ 配置である化合物を得ることができる。

第E' 3工程は、化合物(167)を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物(166)と化合物(141)を反応させることにより達成され、本反応は、前記E法第E3工程と同様に行われる。

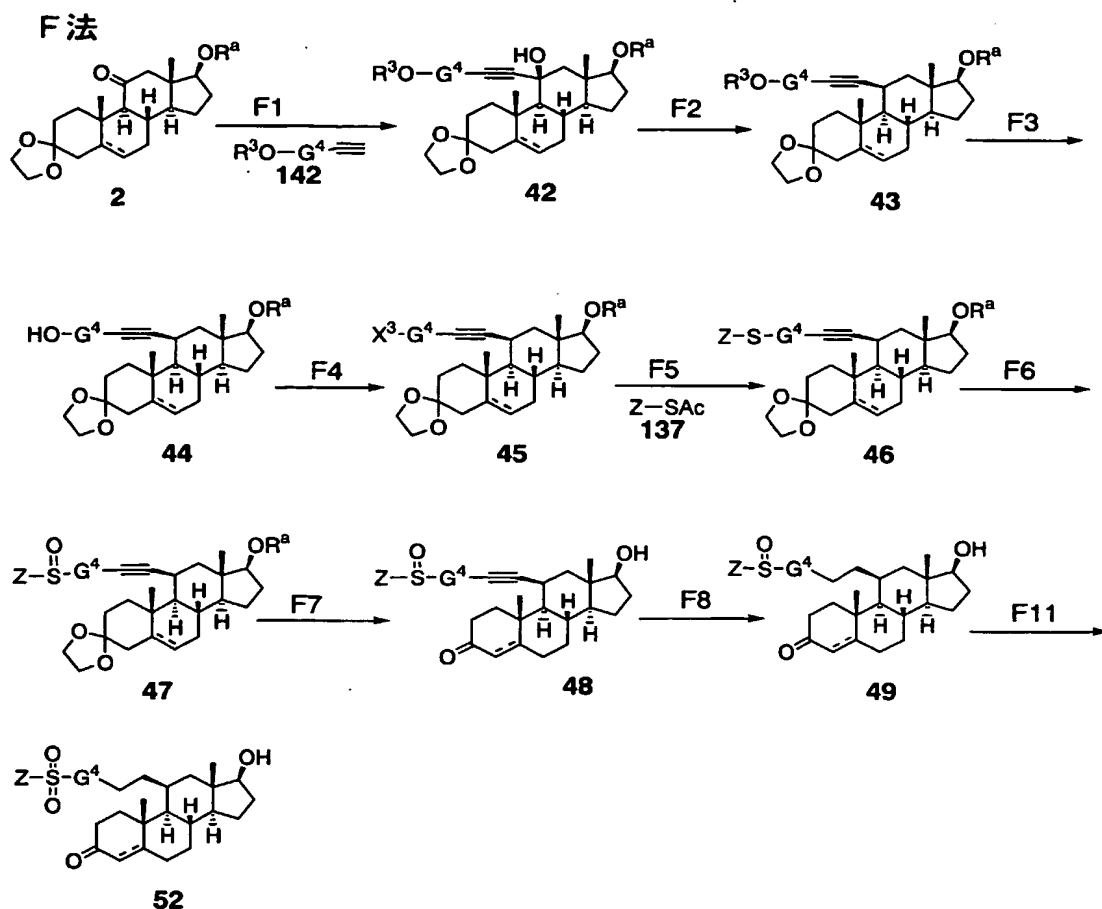
第E' 4工程は、化合物(168)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(167)を酸と反応させるとこにより達成され、本反応は、前記D' 法第D' 5工程と同様に行われる。

5 第E' 5工程は、化合物(247)を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(168)と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A12工程と同様に行われる。

第E' 6工程は、化合物(36)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行われる。

10 F法は、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aがメチレン基であり、R<sup>1</sup>が-CH<sub>2</sub>-G<sup>4</sup>-S(O)-Zであり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>3</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(49)、並びに一般式(I)で表される化合物  
15 のうち、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aがメチレン基であり、R<sup>1</sup>が-CH<sub>2</sub>-G<sup>4</sup>-S(O)<sub>2</sub>-Zであり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>3</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(52)を  
20 製造する方法である。





第F 1工程は、化合物（4 2）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（1 4 2）とアルキルリチウム（好適には、n-ブチルリチウム）を反応させることにより得られる化合物（1 4 2）の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物（2）と反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しなければ、特に限定されないが、好適には、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル類であり、更に好ましくは、テトラヒドロフラン等である。

10 反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、0℃～80℃（好適には、10℃～50℃）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間（好適には、30分間～15時間）である。

第F 2工程は、化合物（4 3）を製造する工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物（4 2）を還元剤と反応させることにより達成され、本反応は、前

記E法第E2工程と同様に行われる。

また、この工程で副生する、化合物(43)の11位の置換基が $\alpha$ 配置である化合物を用いることにより、化合物(49)及び化合物(52)のX'が $\alpha$ 配置である化合物を得ることができる。

- 5 第F3工程は、化合物(44)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(43)と脱保護剤を反応させること、すなわち置換シリル基を除去することにより達成され、本反応は、前記B法第B2工程と同様に行なわれる。

- 第F4工程は、化合物(45)を製造する工程で、アミン系溶媒中、化合物(44)を塩化スルホニル化合物と反応させるか、あるいは、不活性溶媒中、化合物(44)をハロゲン化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記B法第B3工程と同様に行なわれる。
- 10

- 第F5工程は、化合物(46)を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物(137)と金属アルコキシドを反応させることにより得られる化合物(137)の反応性誘導体を、アルコール系溶媒中、化合物(45)と反応させることにより達成され、本反応は、前記B法第B4工程と同様に行なわれる。
- 15

第F6工程は、化合物(47)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(46)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる。

- 第F7工程は、化合物(48)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(47)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A5工程と同様に行われる。
- 20

第F8工程は、化合物(49)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、化合物(48)の接触還元を行うことにより達成される。

- 使用される溶媒は、メタノール、エタノール、n-プロパノール、i-プロパノール、n-ブタノール、s-ブタノール、t-ブタノール、ペンタノール、ヘキサノール、シクロプロパノール、シクロブタノール、シクロペンタノール、シクロヘキサノール、エチレングルコール、1,3-プロパンジオール、1,4-ブタンジオール、1,5-ペンタンジオールのようなアルコール系溶媒、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒
- 25

、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、酢酸エチル、アセトニトリル、ニトロメタン等であり得、好適には、酢酸エチル等である。

接触還元を用いる条件は、例えば、水素-クロロトリス（トリフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-クロロトリス（トリパラトリルホスフィン）ロジウム（I）、水素-クロロトリス（トリパラメトキシフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-ヒドリドカルボニルトリス（トリフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-酢酸ロジウム（II）、水素-酢酸ルテニウム（II）、水素-クロロヒドリドトリス（トリフェニルホスフィン）ルテニウム（II）、水素-カルボキシラトヒドリドトリス（トリフェニルホスフィン）ルテニウム（II）、水素-ヒドリドカルボニルトリス（トリフェニルホスフィン）イリジウム（I）、水素-白金（II）-塩化スズ錯体、水素-ペンタシアノコバルト（II）錯体、水素-トリシアノビピリジンコバルト（II）錯体、水素-ビス（ジメチルグリオキシマト）コバルト（II）錯体、水素-安息香酸メチル-トリカルボニルクロム錯体、水素-ビス（トリカルボニルシクロペンタジエニルクロム）、水素-ペンタカルボニル鉄、水素-ビス（シクロペンタジエニル）ジカルボニルチタン、水素-ヒドリドカルボニルコバルト錯体、水素-オクタカルボニルニコバルト、水素-ヒドリドカルボニルロジウム、水素-クロム（III）アセチルアセトナート-トリイソブチルアルミニウム、水素-コバルト（II）アセチルアセトナート-トリイソブチルアルミニウム、水素-ニッケル（II）-2-ヘキサノアート-トリエチルアルミニウム等の均一系、水素-二酸化白金、水素-白金/炭素、水素-パラジウム/炭素、水素-パラジウム/硫酸バリウム、水素-パラジウム/炭酸カルシウム、水素-ラネ-ニッケル、水素-カッパークロマイト、水素-ロジウム/炭素、水素-ロジウム/アルミナ、水素-二酸化ルテニウム、水素-ルテニウム/炭素等の不均一系条件であり得、好ましくは、水素-パラジウム/炭素等である。

反応温度は、通常0℃～100℃であり、好適には0℃～60℃である。反応

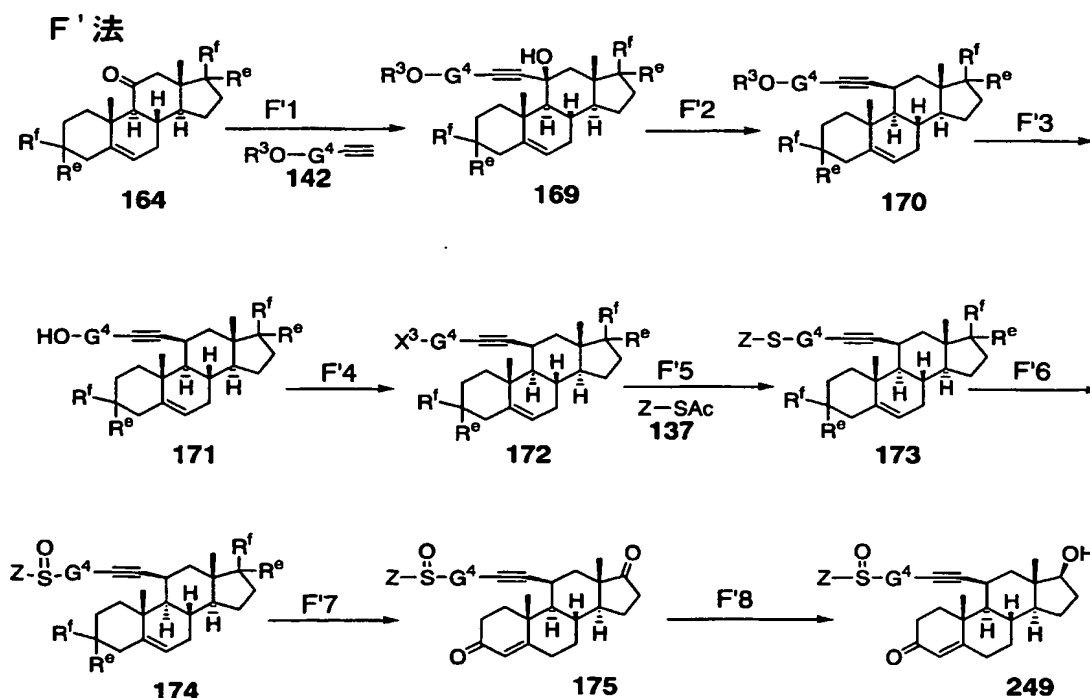
時間は、反応温度等により異なるが、通常、10分間～24時間であり、好適には10分間～6時間である。

また、破線が、実線と共に、二重結合を形成している場合、この反応に付随して、単結合に変換されることもある。

- 5 第F11工程は、化合物(52)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(49)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記B法第B7工程と同様に行われる。

F'法は、化合物(48)の、破線が実線と共に二重結合である化合物(249)を製造する別の方法である。

10



- 第F'1工程は、化合物(169)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(142)とアルキルリチウム(好適には、n-ブチルリチウム)を反応させることにより得られる化合物(142)の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物(164)と反応させることにより達成され、本反応は、前記F法第F1工程と同様に行われる。
- 15

第F' 2工程は、化合物(170)を製造する工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物(169)を還元剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記F法第F 2工程と同様に行われる。

5 また、この工程で副生する、化合物(170)の11位の置換基が $\alpha$ 配置である化合物を用いることにより、化合物(249)のX<sup>1</sup>が $\alpha$ 配置である化合物を得ることができる。

第F' 3工程は、化合物(171)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(170)と脱保護剤を反応させること、すなわち置換シリル基を除去することにより達成され、本反応は、前記F法第F 3工程と同様に行なわれる。

10 第F' 4工程は、化合物(172)を製造する工程で、アミン系溶媒中、化合物(171)を塩化スルホニル化合物と反応させるか、あるいは、不活性溶媒中、化合物(171)をハロゲン化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記F法第F 4工程と同様に行なわれる。

15 第F' 5工程は、化合物(173)を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物(137)と金属アルコキシドを反応させることにより得られる化合物(137)の反応性誘導体を、アルコール系溶媒中、化合物(172)と反応させることにより達成され、本反応は、前記F法第F 5工程と同様に行なわれる。

20 第F' 6工程は、化合物(174)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(173)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記F法第F 6工程と同様に行われる。

第F' 7工程は、化合物(175)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(174)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記E'法第E' 4工程と同様に行われる。

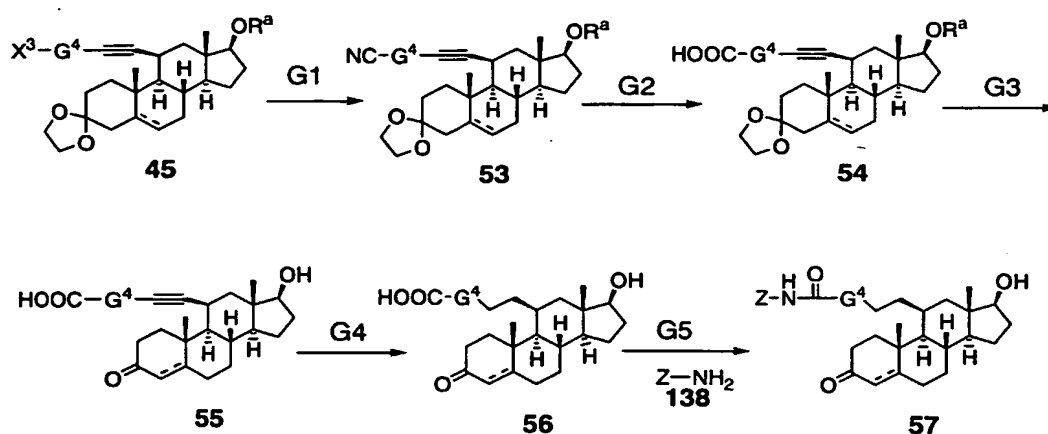
25 第F' 8工程は、化合物(249)を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(175)と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記E'法第E' 5工程と同様に行われる。

G法は、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aがメチレン基であり、R<sup>1</sup>が $-\text{CH}_2-\text{G}^4-\text{COOH}$ であり、X<sup>2</sup>

が水素原子であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(56)、並びに一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が $-CH_2-G^4-CONH-Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(57)を製造する方法である。

10

## G法



第G1工程は、化合物(53)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(45)をシアノ化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C1工程と同様に行われる。

第G2工程は、化合物(54)を製造する工程で、化合物(53)を塩基の存在下加水分解することにより達成され、本反応は、前記C法第C2工程と同様に行われる。

第G3工程は、化合物(55)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(54)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A5工程と同様に行われる。

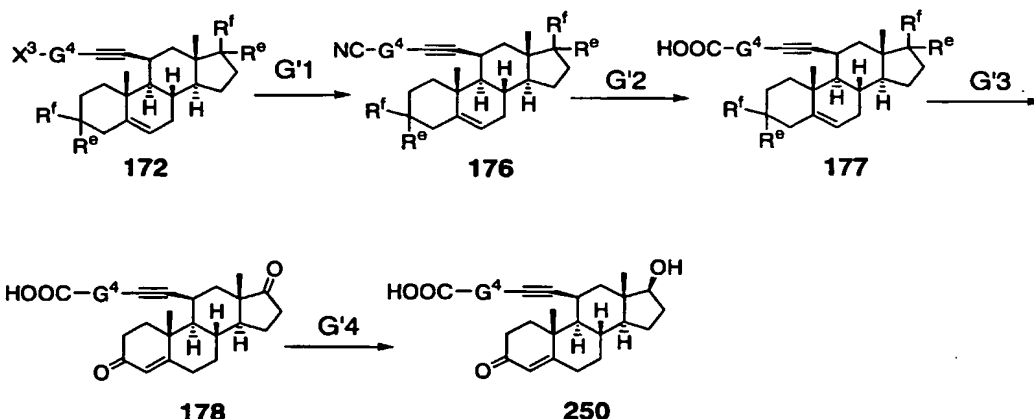
第G 4工程は、化合物（5 6）を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記F 法第F 8工程と同様に行われる。

また、破線が、実線と共に、二重結合を形成している場合、この反応に付随して、単結合に変換されることもある。

第G 5工程は、化合物（5 7）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（5 6）又はその反応性誘導体（酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類）と、化合物（1 3 8）又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記C 法第C 3工程と同様に行われる。

G' 法は、化合物（5 5）の、破線が実線と共に二重結合である化合物（2 5 0）を製造する別の方法である。

#### G' 法



第G' 1工程は、化合物（1 7 6）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（1 7 2）をシアノ化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記G 法第G 1工程と同様に行われる。

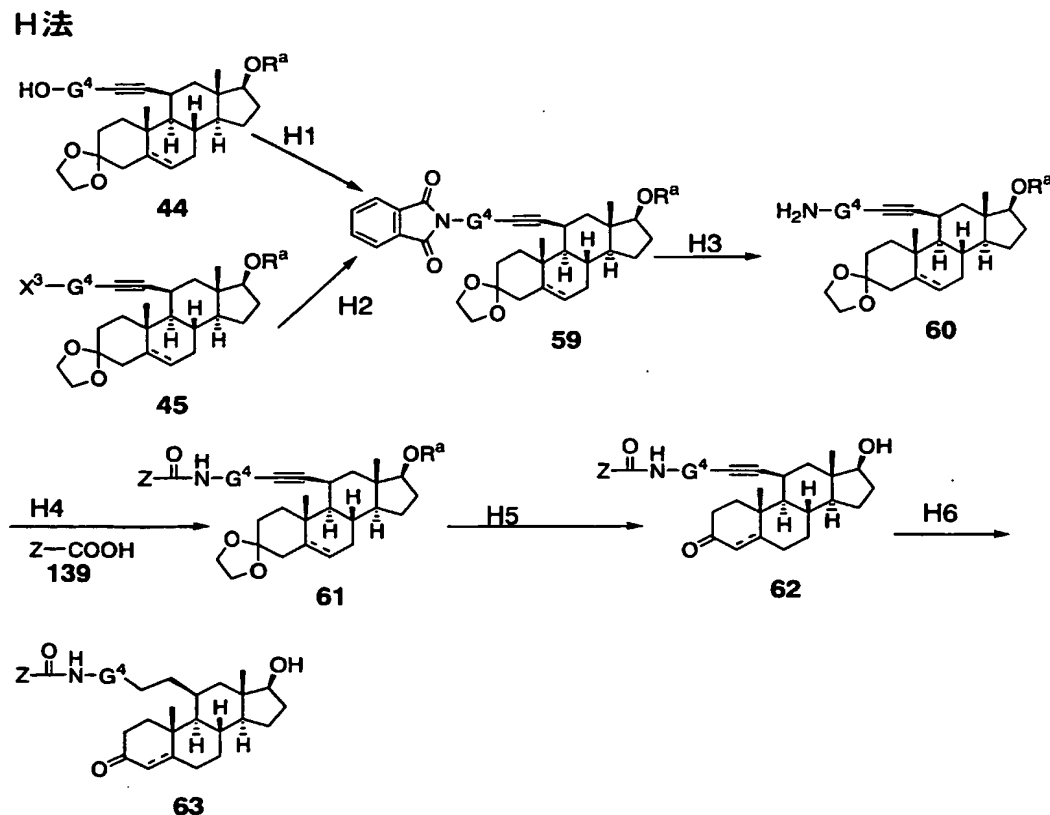
第G' 2工程は、化合物（1 7 7）を製造する工程で、化合物（1 7 6）を塩基の存在下加水分解することにより達成され、本反応は、前記G 法第G 2工程と同様に行われる。

第G' 3工程は、化合物（1 7 8）を製造する工程で、水系溶媒中、化合物（

177) を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記F' 法第F' 7工程と同様に行われる。

第G' 4工程は、化合物(250)を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(178)と還元剤を反応させることにより達成され、本  
5 反応は、前記F' 法第F' 8工程と同様に行われる。

H法は、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式(I I)で表される基であり、かつその一般式(I I)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aがメチレン基であり、R<sup>1</sup>が-CH<sub>2</sub>-G<sub>4</sub>-NHCO-Zであり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合して  
10 いる3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(63)を製造する方法である。





第H 1工程は、化合物（5 9）を製造する工程で、不活性溶媒中、アゾジカルボン酸ジアルキルエステル（好適には、アゾジカルボン酸ジエチル）及びホスフィン化合物（好適には、トリフェニルホスフィン）の存在下、化合物（4 4）をフタルイミドと反応させることにより達成され、本反応は、前記D法第D 1工程と同様に行われる。

第H 2工程は、化合物（5 9）を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物（4 5）をフタルイミドの金属塩（好適には、フタルイミドカリウム）と反応させることにより達成され、本反応は、前記D法第D 2工程と同様に行われる。

第H 3工程は、化合物（6 0）を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物（5 9）を、アミン系化合物（好適には、ヒドラジン）と反応させることにより達成され、本反応は、前記D法第D 3工程と同様に行われる。

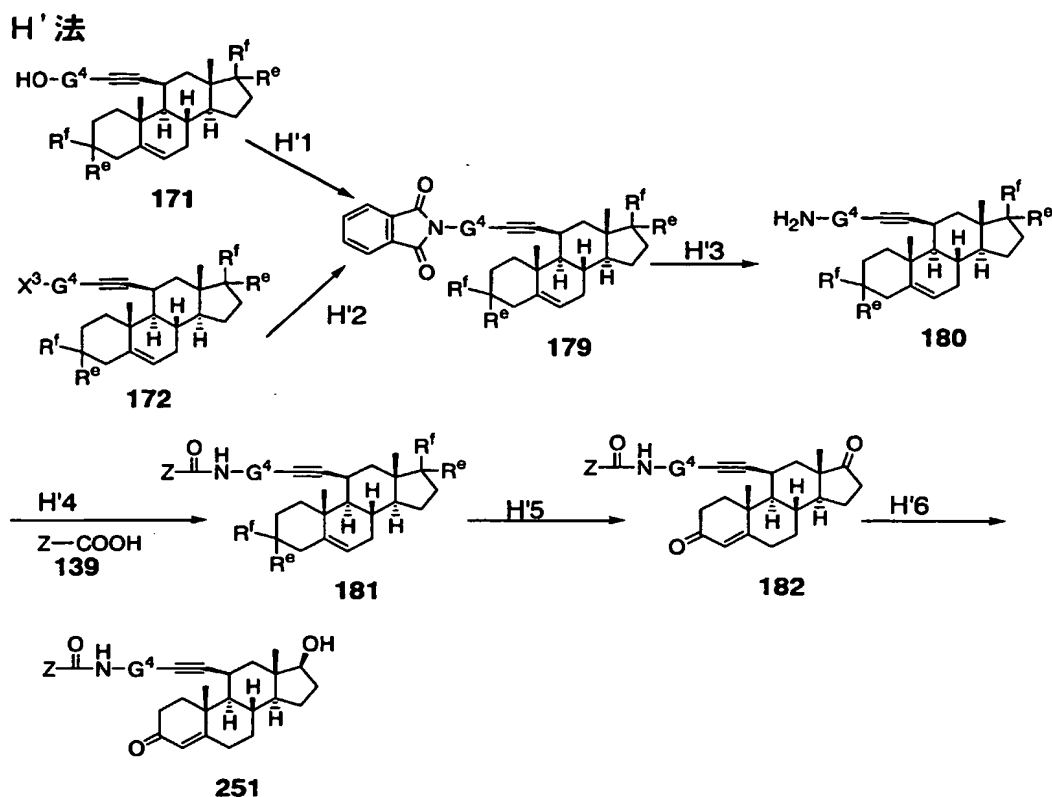
第H 4工程は、化合物（6 1）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（1 3 9）又はその反応性誘導体（酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類）と、化合物（6 0）又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C 3工程と同様に行われる。

第H 5工程は、化合物（6 2）を製造する工程で、水系溶媒中、化合物（6 1）を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A 5工程と同様に行われる。

第H 6工程は、化合物（6 3）を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記F法第F 8工程と同様に行われる。

また、破線が、実線と共に、二重結合を形成している場合、この反応に付随して、単結合に変換されることもある。

H' 法は、化合物（6 2）の、破線が実線と共に二重結合である化合物（2 5 1）を製造する別の方法である。



第H' 1工程は、化合物（179）を製造する工程で、不活性溶媒中、アゾジカルボン酸ジアルキルエステル（好適には、アゾジカルボン酸ジエチル）及びホスフィン化合物（好適には、トリフェニルホスフィン）の存在下、化合物（171）をフタルイミドと反応させることにより達成され、本反応は、前記H法第H 1工程と同様に行われる。

第H' 2工程は、化合物（179）を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物（172）をフタルイミドの金属塩（好適には、フタルイミドカリウム）と反応させることにより達成され、本反応は、前記H法第H 2工程と同様に行われる。

第H' 3工程は、化合物（180）を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物（179）を、アミン系化合物（好適には、ヒドラジン）と反応させることにより達成され、本反応は、前記H法第H 3工程と同様に行われる。

第H' 4工程は、化合物（181）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（139）又はその反応性誘導体（酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステ

ル類) と、化合物 (180) 又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記H法第H4工程と同様に行われる。

第H' 5工程は、化合物 (182) を製造する工程で、水系溶媒中、化合物 (181) を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記G' 法第G' 3工程と同様に行われる。

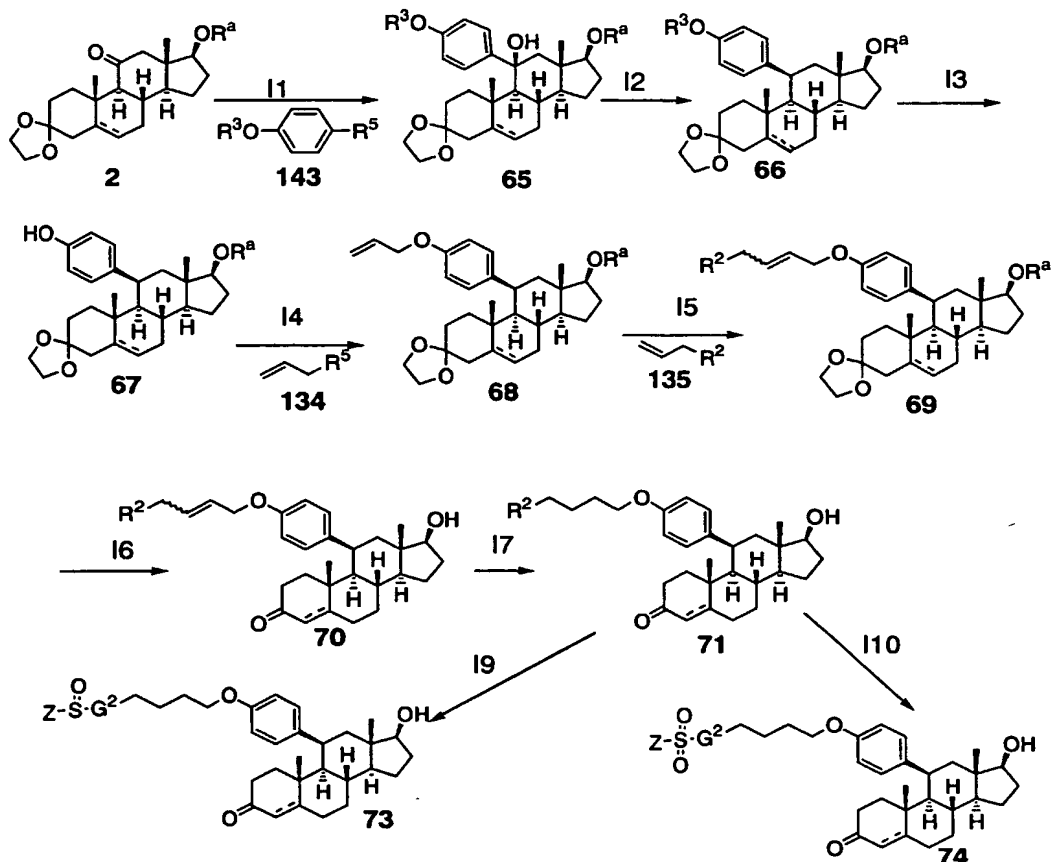
第H' 6工程は、化合物 (251) を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物 (182) と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記G' 法第G' 4工程と同様に行われる。

I 法は、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基 (好ましくはp-フェニレン基) であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-CH_2-CH=CH-CH_2-R^2$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (70)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基 (好ましくはp-フェニレン基) であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4-R^2$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (71)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基 (好ましくはp-フェニレン基) であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4-G^2-S(O)-Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (73)、並びに一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基 (好ましくはp-フェニレン基) であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4$

—G<sup>2</sup>—S(O)<sub>2</sub>—Zであり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって—(C=O)—であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(74)を製造する方法である。

5

## I 法



第I1工程は、化合物(65)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(143)と金属(好適には、マグネシウム)又はアルキルリチウム(好適には、n-ブチルリチウム)を反応させることにより得られる化合物(143)の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物(2)と反応させることにより達成される。使用される不活性溶媒は、反応に関与しなければ、特に限定されないが、好適には、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエ

ーテル類であり、更に好ましくは、テトラヒドロフラン等である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $0^{\circ}\text{C}\sim 80^{\circ}\text{C}$ （好適には、 $10^{\circ}\text{C}\sim 50^{\circ}\text{C}$ ）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間（好適には、30分間～15時間）である。

- 5 第I2工程は、化合物（66）を製造する工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物（65）を還元剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記E法第E2工程と同様に行われる。

また、この工程で副生する、化合物（66）の11位の $-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OR}^3$ が $\alpha$ 配置である化合物を用いることにより、化合物（70）、化合物（71）、化合物  
10 （73）、及び化合物（74）の $\text{X}^1$ が $\alpha$ 配置である化合物を得ることができる。

さらに、化合物（66）及びその11位の $-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OR}^3$ が $\alpha$ 配置である化合物の合成にあたっては、Tetrahedron, vol. 52, 1529-1542, 1996に開示された各種の芳香族炭化水素基の導入法を参照することもできる。

- 15 第I3工程は、化合物（67）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（66）と脱保護剤を反応させること、すなわち置換シリル基を除去することにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応を阻害しないものであれば、特に限定されないが、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ジメチルホルムアミド、水等であり、好適には、テトラ  
20 ヒドロフラン等である。使用される脱保護剤は、特に限定されないが、例えば、フッ化水素、フッ化水素-ピリジン、フッ化ナトリウム、フッ化カリウム、フッ化テトラ- $n$ -ブチルアンモニウムのようなフッ化物、蟻酸、酢酸、 $p$ -トルエンスルホン酸のような有機酸であり、好ましくは、フッ化テトラ- $n$ -ブチルアンモニウム等である。

- 25 反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $0^{\circ}\text{C}\sim 80^{\circ}\text{C}$ （好適には、 $0^{\circ}\text{C}\sim 50^{\circ}\text{C}$ ）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間（好適には、30分間～15時間）である。

第I4工程は、化合物（68）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（67）に塩基を反応させることにより得られる化合物（67）の塩を、不活性溶媒

中、化合物（１３４）と反応させることにより達成され、本反応は、前記Ａ法第Ａ３工程と同様に行われる。

第Ｉ５工程は、化合物（６９）を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物（６８）と化合物（１３５）を反応させることにより達成され、本反応は、前記Ａ法第Ａ４工程と同様に行われる。

第Ｉ６工程は、化合物（７０）を製造する工程で、水系溶媒中、化合物（６９）を酸と反応させるとこにより達成され、本反応は、前記Ａ法第Ａ５工程と同様に行われる。

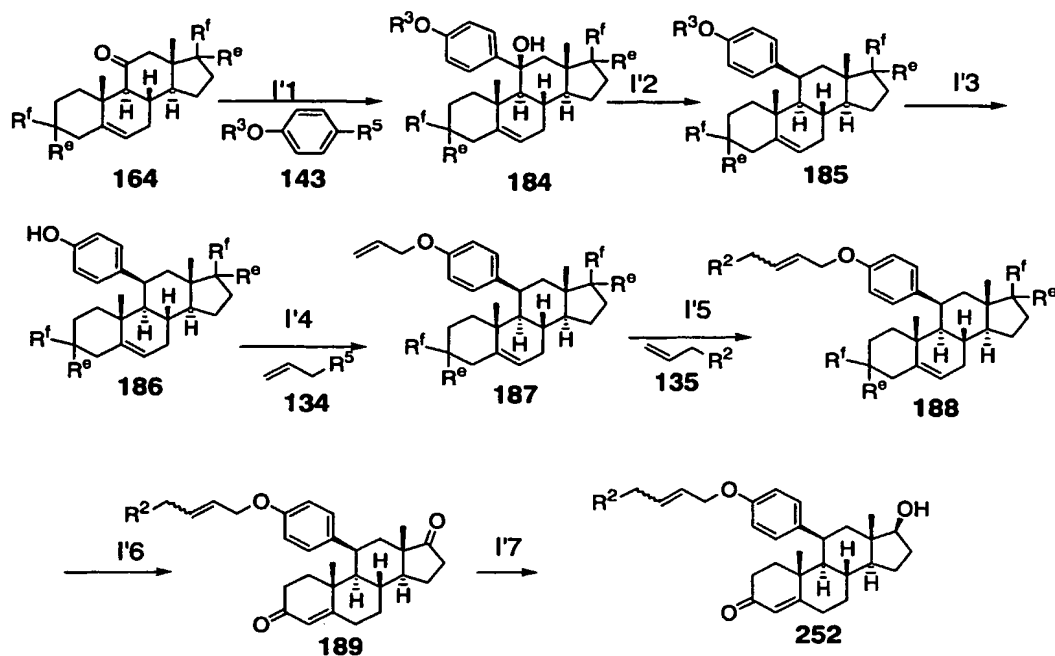
第Ｉ７工程は、化合物（７１）を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記Ａ法第Ａ６工程と同様に行われる。

第Ｉ９工程は、化合物（７１）の $R^2$ における $Q^2$ が－Ｓ－である場合、化合物（７３）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（７１）を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記Ａ法第Ａ８工程と同様に行われる。

第Ｉ１０工程は、化合物（７４）の $R^2$ における $Q^2$ が－Ｓ－である場合、化合物（７４）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（７１）を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記Ａ法第Ａ９工程と同様に行われる。

Ｉ'法は、化合物（７０）の、破線が実線と共に二重結合である化合物（２５２）を製造する別の方法である。

## I' 法



第 I' 1 工程は、化合物 (184) を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物 (143) と金属 (好適には、マグネシウム) 又はアルキルリチウム (好適には、*n*-ブチルリチウム) を反応させることにより得られる化合物 (143) の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物 (164) と反応させることにより達成され、本反応は、前記 I 法第 I 1 工程と同様に行われる。

第 I' 2 工程は、化合物 (185) を製造する工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物 (184) を還元剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記 I 法第 I 2 工程と同様に行われる。

また、この工程で副生する、化合物 (185) の 11 位の  $-C_6H_4-OR^3$  が  $\alpha$  配置である化合物を用いることにより、化合物 (252) の  $X^1$  が  $\alpha$  配置である化合物を得ることができる。

さらに、化合物 (185) 及びその 11 位の  $-C_6H_4-OR^3$  が  $\alpha$  配置である化合物の合成にあたっては、Tetrahedron, vol. 52, 1529-1542, 1996 に開示された各種の芳香族炭化水素基の導入法を参照することもできる。

第 I' 3 工程は、化合物 (186) を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物 (185) と脱保護剤を反応させること、すなわち置換シリル基を除去すること

により達成され、本反応は、前記 I 法第 I 3 工程と同様に行われる。

第 I' 4 工程は、化合物 (187) を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物 (186) に塩基を反応させることにより得られる化合物 (186) の塩を、不活性溶媒中、化合物 (134) と反応させることにより達成され、本反応は、前記 I 法第 I 4 工程と同様に行われる。

第 I' 5 工程は、化合物 (188) を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物 (187) と化合物 (135) を反応させることにより達成され、本反応は、前記 I 法第 I 5 工程と同様に行われる。

第 I' 6 工程は、化合物 (189) を製造する工程で、水系溶媒中、化合物 (188) を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記 H' 法第 H' 5 工程と同様に行われる。

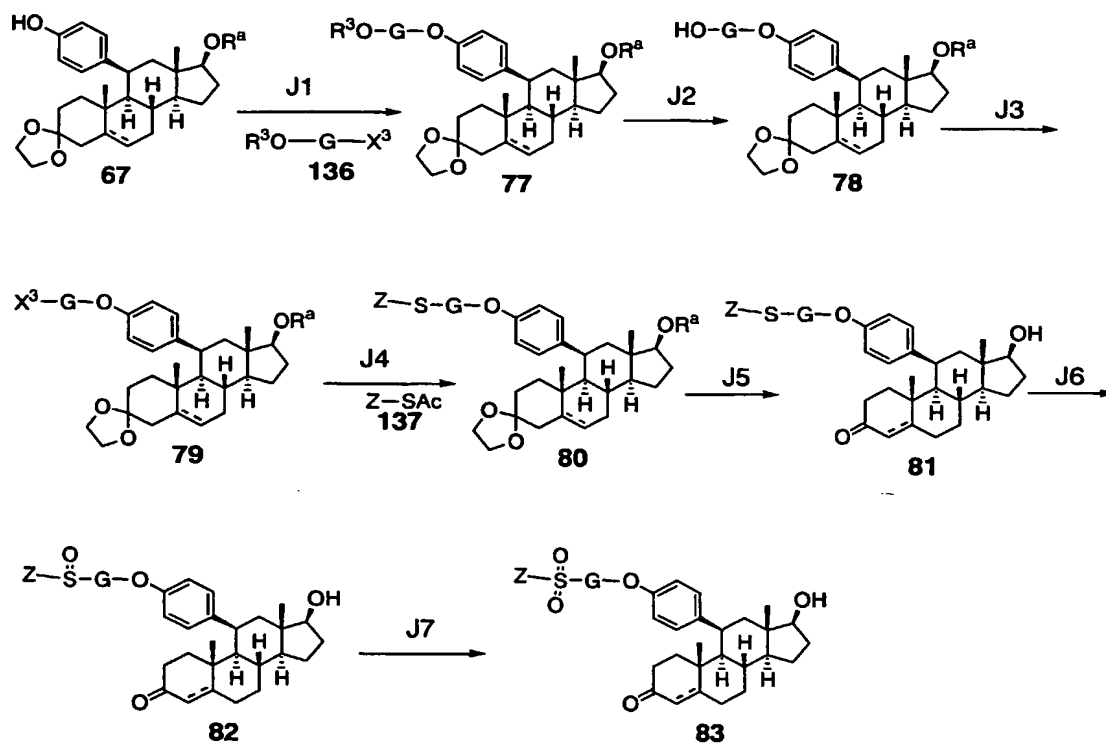
第 I' 7 工程は、化合物 (252) を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物 (189) と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記 H' 法第 H' 6 工程と同様に行われる。

J 法は、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が、 $\beta$  配置の、一般式 (II) で表される基であり、かつその一般式 (II) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは p-フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-G-S-Z$  であり、 $X^2$  が水素原子であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒にあって  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (81)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が、 $\beta$  配置の、一般式 (II) で表される基であり、かつその一般式 (II) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは p-フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-G-S(O)-Z$  であり、 $X^2$  が水素原子であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒にあって  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (82)、並びに一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が、 $\beta$  配置の、一般式 (II) で表される基であり、かつその一般式 (II) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは p-フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-G-S(O)_2-Z$  であり、



$X^2$ が水素原子であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(83)を製造する方法である。

### J 法



5

第J1工程は、化合物(77)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(67)に塩基を反応させることにより得られる化合物(67)の塩を、不活性溶媒中、化合物(136)と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A3工程と同様に行われる。

第J2工程は、化合物(78)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(77)と脱保護剤を反応させること、すなわち置換シリル基を除去することにより達成され、本反応は、前記B法第B2工程と同様に行われる。

第J3工程は、化合物(79)を製造する工程で、アミン系溶媒中、化合物(78)を塩化スルホニル化合物と反応させるか、あるいは、不活性溶媒中、化合物(78)をハロゲン化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記B

15

法第B 3工程と同様に行われる。

第J 4工程は、化合物(8 0)を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物(1 3 7)と金属アルコキシドを反応させることにより得られる化合物(1 3 7)の反応性誘導体を、アルコール系溶媒中、化合物(7 9)と反応させることにより達成され、本反応は、前記B法第B 4工程と同様に行われる。

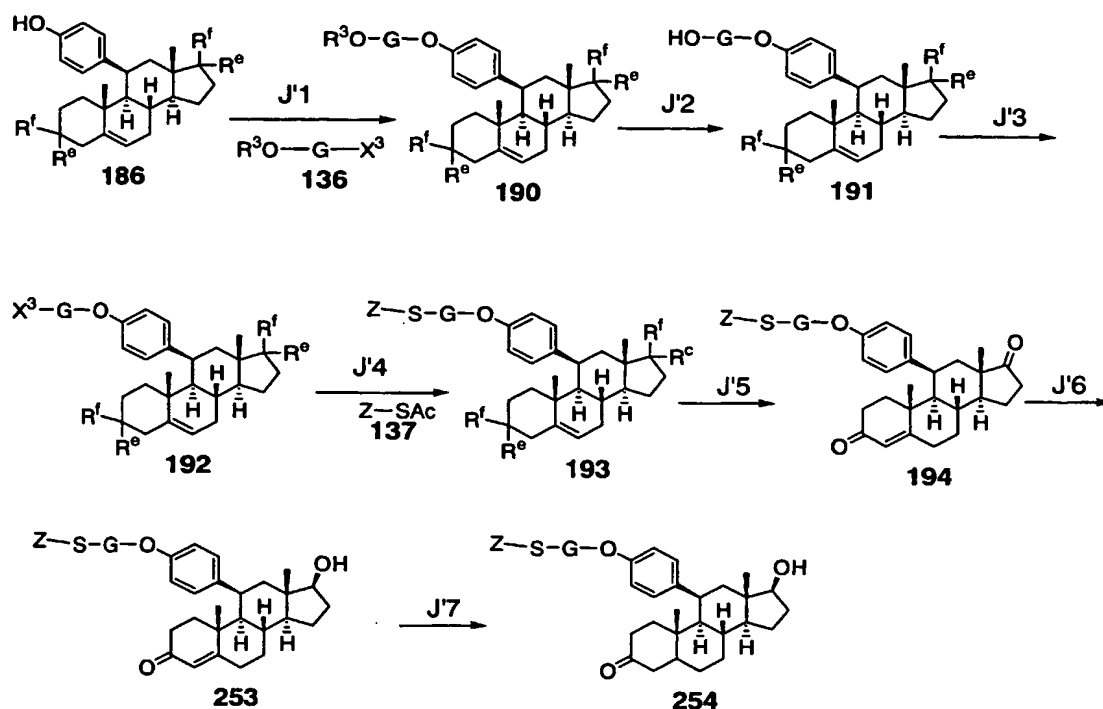
第J 5工程は、化合物(8 1)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(8 0)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A 5工程と同様に行われる。

第J 6工程は、化合物(8 2)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(8 1)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A 8工程と同様に行われる。

第J 7工程は、化合物(8 3)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(8 2)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記B法第B 7工程と同様に行われる。

J'法は、化合物(8 1)の、破線が実線と共に二重結合である化合物(2 5 3)及び、化合物(8 1)の、破線が実線と共に単結合である化合物(2 5 4)を製造する別の方法である。

## J' 法



第J' 1工程は、化合物（190）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（186）に塩基を反応させることにより得られる化合物（186）の塩を、不活性溶媒中、化合物（136）と反応させることにより達成され、本反応は、前記J法第J1工程と同様に行われる。

第J' 2工程は、化合物（191）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（190）と脱保護剤を反応させること、すなわち置換シリル基を除去することにより達成され、本反応は、前記J法第J2工程と同様に行われる。

第J' 3工程は、化合物（192）を製造する工程で、アミン系溶媒中、化合物（191）を塩化スルホニル化合物と反応させるか、あるいは、不活性溶媒中、化合物（191）をハロゲン化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記J法第J3工程と同様に行われる。

第J' 4工程は、化合物（193）を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物（137）と金属アルコキシドを反応させることにより得られる化合物（137）の反応性誘導体を、アルコール系溶媒中、化合物（192）と反応させ

ることにより達成され、本反応は、前記 J 法第 J 4 工程と同様に行われる。

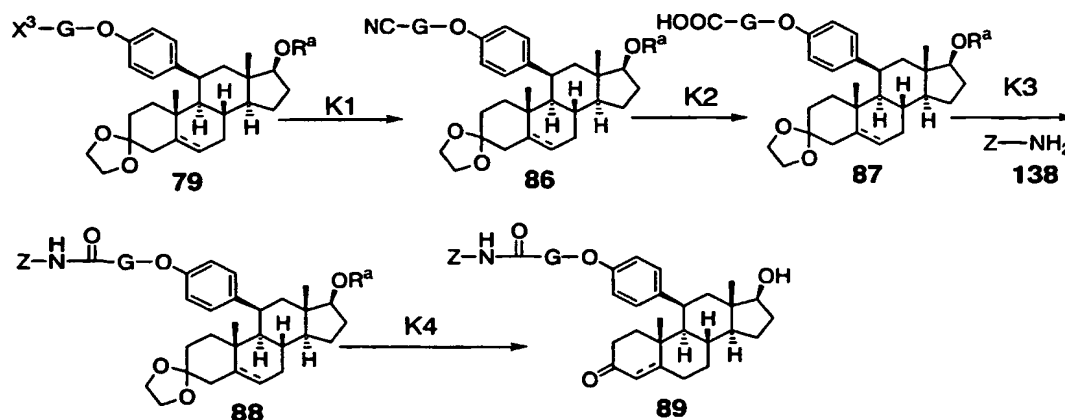
第 J' 5 工程は、化合物 (194) を製造する工程で、水系溶媒中、化合物 (193) を酸と反応させるとこにより達成され、本反応は、前記 I' 法第 I' 6 工程と同様に行われる。

- 5 第 J' 6 工程は、化合物 (253) を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物 (194) と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記 I' 法第 I' 7 工程と同様に行われる。

- 10 第 J' 7 工程は、化合物 (254) を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、化合物 (253) の接触還元を行なうか、又は、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物 (253) と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記 C' 法第 C' 6 工程と同様に行われる。

- 15 K 法は、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が、 $\beta$  配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは p-フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-G-CONH-Z$  であり、 $X^2$  が水素原子であり、 $R^2$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒に  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (89) を製造する方法である。

#### K 法



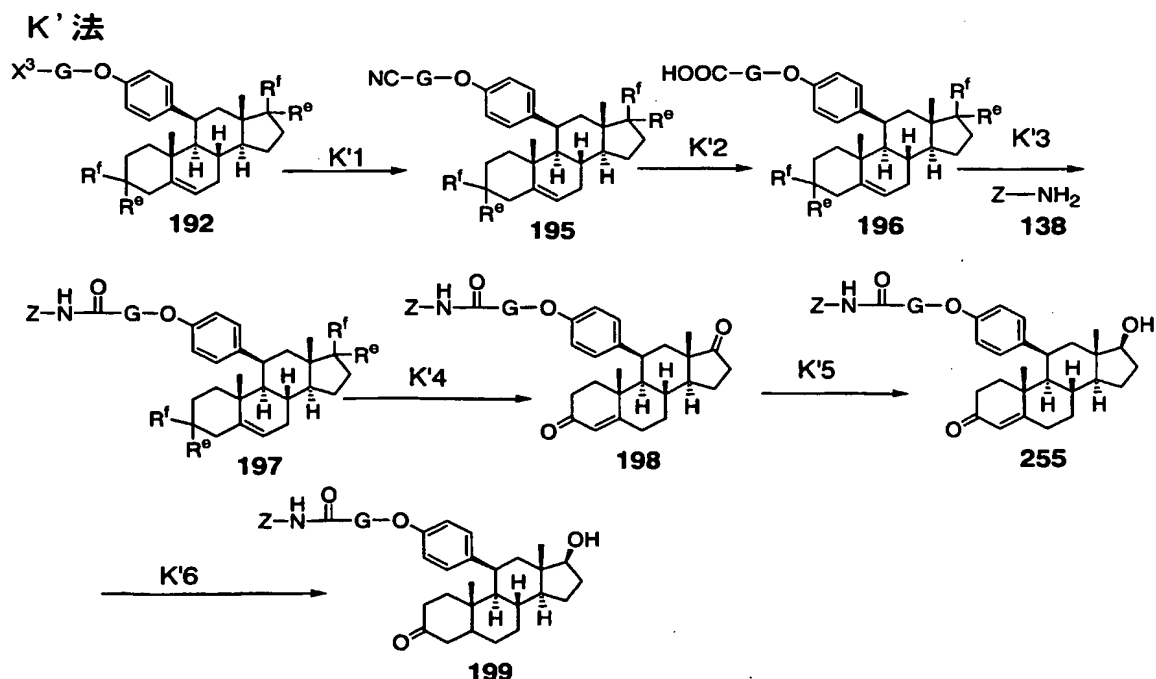
第K 1工程は、化合物（8 6）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（7 9）をシアノ化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C 1工程と同様に行われる。

第K 2工程は、化合物（8 7）を製造する工程で、化合物（8 6）を塩基の存在下加水分解することにより達成され、本反応は、前記C法第C 2工程と同様に行われる。

第K 3工程は、化合物（8 8）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（8 7）又はその反応性誘導体（酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類）と、化合物（1 3 8）又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C 3工程と同様に行われる。

第K 4工程は、化合物（8 9）を製造する工程で、水系溶媒中、化合物（8 8）を酸と反応させるとこにより達成され、本反応は、前記A法第A 5工程と同様に行われる。

K' 法は、化合物（8 9）の、破線が実線と共に二重結合である化合物（2 5 5）及び、化合物（8 9）の、破線が実線と共に単結合である化合物（1 9 9）を製造する方法である。



第K' 1工程は、化合物(195)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(192)をシアノ化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記K法第K 1工程と同様に行われる。

5 第K' 2工程は、化合物(196)を製造する工程で、化合物(195)を塩基の存在下加水分解することにより達成され、本反応は、前記K法第K 2工程と同様に行われる。

10 第K' 3工程は、化合物(197)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(196)又はその反応性誘導体(酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類)と、化合物(138)又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記K法第K 3工程と同様に行われる。

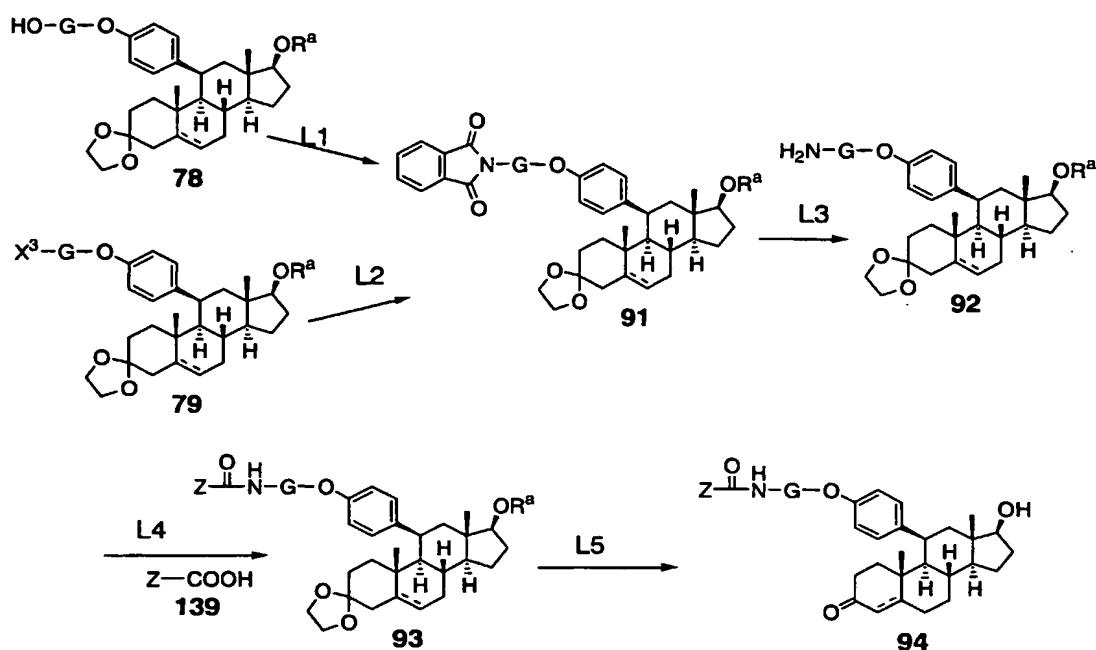
第K' 4工程は、化合物(198)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(197)を酸と反応させるとこにより達成され、本反応は、前記J'法第J' 5工程と同様に行われる。

15 第K' 5工程は、化合物(255)を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(198)と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記J'法第J' 6工程と同様に行われる。

20 K' 6工程は、化合物(199)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、化合物(255)の接触還元を行なうか、又は、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(255)と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記C'法第C' 6工程と同様に行われる。

25 L法は、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、A<sub>r</sub>が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、Aが-O-であり、R<sup>1</sup>が-G-NHCO-Zであり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(94)を製造する方法である。

## L 法



第L 1工程は、化合物（9 1）を製造する工程で、不活性溶媒中、アゾジカルボン酸ジアルキルエステル（好適には、アゾジカルボン酸ジエチル）及びホスフィン化合物（好適には、トリフェニルホスフィン）の存在下、化合物（7 8）をフタルイミドと反応させることにより達成され、本反応は、前記D法第D 1工程と同様に行われる。

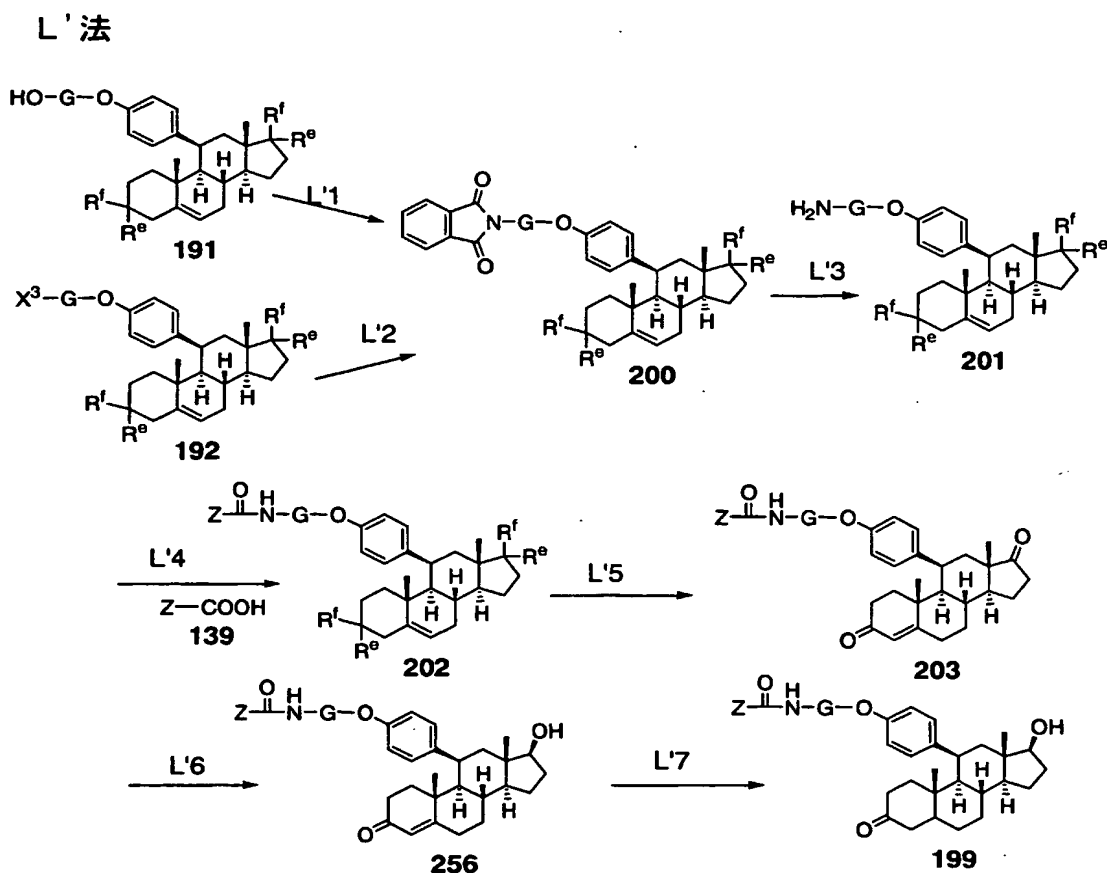
第L 2工程は、化合物（9 1）を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物（7 9）をフタルイミドの金属塩（好適には、フタルイミドカリウム）と反応させることにより達成され、本反応は、前記D法第D 2工程と同様に行われる。

第L 3工程は、化合物（9 2）を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物（9 1）を、アミン系化合物（好適には、ヒドラジン）と反応させることにより達成され、本反応は、前記D法第D 3工程と同様に行われる。

第L 4工程は、化合物（9 3）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（1 3 9）又はその反応性誘導体（酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類）と、化合物（9 2）又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C 3工程と同様に行われる。

第L 5工程は、化合物（94）を製造する工程で、水系溶媒中、化合物（93）を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A 5工程と同様に行われる。

L' 法は、化合物（94）の、破線が実線と共に二重結合である化合物（256）、及び化合物（94）の、破線が実線と共に単結合である化合物（199）を製造する別の方法である。



10

第L' 1工程は、化合物（200）を製造する工程で、不活性溶媒中、アゾジカルボン酸ジアルキルエステル（好適には、アゾジカルボン酸ジエチル）及びホスフィン化合物（好適には、トリフェニルホスフィン）の存在下、化合物（191）をフタルイミドと反応させることにより達成され、本反応は、前記L法第L 1工程と同様に行われる。

15



第L' 2工程は、化合物(200)を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物(192)をフタルイミドの金属塩(好適には、フタルイミドカリウム)と反応させることにより達成され、本反応は、前記L法第L 2工程と同様に行われる。

- 5 第L' 3工程は、化合物(201)を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物(200)を、アミン系化合物(好適には、ヒドラジン)と反応させることにより達成され、本反応は、前記L法第L 3工程と同様に行われる。

- 10 第L' 4工程は、化合物(202)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(139)又はその反応性誘導体(酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類)と、化合物(201)又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記L法第L 4工程と同様に行われる。

第L' 5工程は、化合物(203)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(202)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記K'法第K' 4工程と同様に行われる。

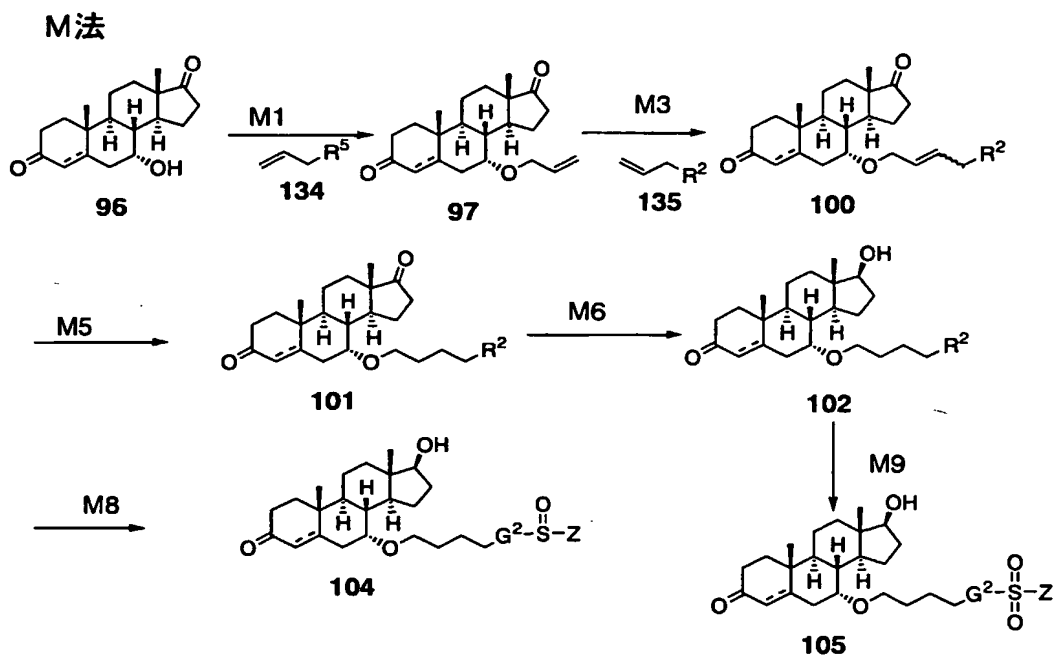
- 15 第L' 6工程は、化合物(256)を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(203)と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記K'法第K' 5工程と同様に行われる。

- 20 L' 7工程は、化合物(199)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、化合物(256)の接触還元を行なうか、又は、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(256)と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記C'法第C' 6工程と同様に行われる。

- 25 M法は、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が水素原子であり、X<sup>2</sup>が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aが-O-であり、R<sup>1</sup>が-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-R<sup>2</sup>であり、R<sup>3</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(102)、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が水素原子であり、X<sup>2</sup>が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aが-O-であり、R<sup>1</sup>

が $-(CH_2)_4-G^2-S(O)-Z$ であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(104)、並びに一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4-G^2-S(O)_2-Z$ であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(105)を製造する方法である。

10



第M1工程は、化合物(97)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(96)に塩基を反応させることにより得られる化合物(96)の塩を、不活性溶媒中、化合物(134)と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A3工程と同様に行われる。

また、化合物(96)の7位の水酸基が、 $\beta$ 配置である化合物も、例えばJ. Org. Chem., 26, 2856-2859 (1961)により公知であり、これを化合物(96)の代わ

りに用いることにより、化合物(102)、化合物(104)、及び化合物(105)の $X^2$ が $\beta$ 配置である化合物を得ることができる。

第M3工程は、化合物(100)を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物(97)と化合物(135)を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A4工程と同様に行われる。

第M5工程は、化合物(101)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行われる。

第M6工程は、化合物(102)を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(101)と還元剤を反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定されないが、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、メタノール、エタノールのようなアルコール系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ピリジン、トリエチルアミンのようなアミン類であり、好適にはメタノール、エタノールのようなアルコール系溶媒であり、さらに好適にはメタノール等である。使用される還元剤は、例えば、水素化アルミニウムリチウム、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム、水素化トリ-*t*-ブトキシアルミニウムリチウム、水素化アルミニウムリチウム-トリクロロアルミニウム(アラン)、水素化アルミニウムリチウム-三フッ化ホウ素、水素化アルミニウム塩化マグネシウム、水素化アルミニウムマグネシウム、水素化アルミニウムナトリウム、水素化トリエトキシアルミニウムナトリウム、水素化ビス(メトキシエトキシ)アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム-パラジウム/炭素、硫化水素化ホウ素ナトリウム、シアン化水素化ホウ素ナトリウム、水素化トリメトキシホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、シアン化水素化ホウ素リチウム、水素化トリエチルホウ素リチウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素リチウム、水素化トリ-*t*-ブチルホウ素リチウム、水素化ホウ素カルシウム、水素化ホウ素カリウム、水素化トリイソプロポキシホウ素カリウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素カリウム、水素化ホウ素亜鉛、水素化ホウ素テトラメチルアン

モニウム、水素化シアノホウ素テトラ-*n*-ブチルアンモニウムのような金属水素錯化合物、水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化トリフェニルスズ、水素化トリ-*n*-ブチルスズ、水素化ジフェニルスズ、水素化ジ-*n*-ブチルスズ、水素化トリエチルスズ、水素化トリメチルスズ、トリクロシラン/トリ-*n*-ブチルアミン、トリクロロシラン/トリ-*n*-プロピルアミン、トリエチルシラン、トリメチルシラン、ジフェニルシラン、フェニルシラン、ポリメチルヒドロシロキサン、ジメチルフェニルシラン、ジ-*n*-ブチルシラン、メチルフェニルシランのような金属水素化物、ジボラン、ジメチルアミン-ボラン、トリメチルアミン-ボラン、エチレンジアミン-ボラン、ピリジン-ボラン、ジメチルスルフィド-ボラン、2, 3-ジメチル-2-ブチルボラン(thexylborane)、ビス-3-メチル-2-ブチルボラン(disiamylborane)、ジイソピノカンフェニルボラン、ジシクロヘキシルボラン、9-ボラビシクロ[3, 3, 1]ノナン(9-BBN)のようなボラン誘導体であり、好適には水素化アルミニウムリチウム、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム、水素化トリ-*t*-ブトキシアルミニウムリチウム、水素化アルミニウムリチウム-トリクロロアルミニウム(アラン)、水素化アルミニウムリチウム-三フッ化ホウ素、水素化アルミニウム塩化マグネシウム、水素化アルミニウムマグネシウム、水素化アルミニウムナトリウム、水素化トリエトキシアルミニウムナトリウム、水素化ビス(メトキシエトキシ)アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム-パラジウム/炭素、硫化水素化ホウ素ナトリウム、シアニ化水素化ホウ素ナトリウム、水素化トリメトキシホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、シアニ化水素化ホウ素リチウム、水素化トリエチルホウ素リチウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素リチウム、水素化トリ-*t*-ブチルホウ素リチウム、水素化ホウ素カルシウム、水素化ホウ素カリウム、水素化トリイソプロポキシホウ素カリウム、水素化トリ-*s*-ブチルホウ素カリウム、水素化ホウ素亜鉛、水素化ホウ素テトラメチルアンモニウム、水素化シアノホウ素テトラ-*n*-ブチルアンモニウムのような金属水素錯化合物であり、さらに好適には水素化ホウ素ナトリウム等である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、-30℃~100℃であり、好適には0℃~70℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分

間～48時間であり、好適には30分間～24時間である。

第M8工程は、化合物(102)の $R^2$ における $Q^2$ が-S-である場合、化合物(104)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(102)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる

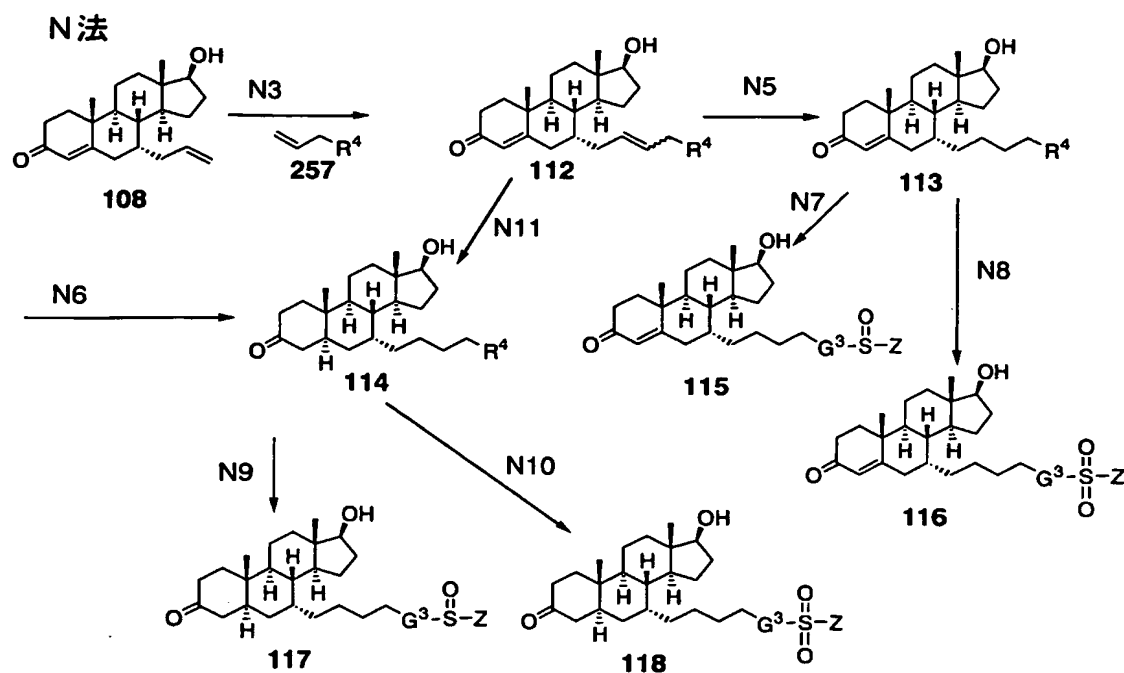
5 。

第M9工程は、化合物(102)の $R^2$ における $Q^2$ が-S-である場合、化合物(105)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(102)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる

。

- 10 N法は、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が-CH=CH-CH<sub>2</sub>- $R^4$ であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に二重結合である化合物(112)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>- $R^4$ であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に二重結合である化合物(113)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>- $R^4$ であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合である化合物(114)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-G<sup>3</sup>-S(O)-Zであり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にな
- 15
- 20
- 25

- って  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に二重結合である化合物 (115)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が水素原子であり、 $X^2$  が、 $\alpha$  配置の、一般式 (II) で表される基であり、かつその一般式 (II) で表される基のうち、 $A_r$  が単結合であり、 $A$  がメチレン基であり、 $R^1$  が  $-(CH_2)_3-G^3$
- 5  $-S(O)_2-Z$  であり、 $R^a$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒に  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に二重結合である化合物 (116)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が水素原子であり、 $X^2$  が、 $\alpha$  配置の、一般式 (II) で表される基であり、かつその一般式 (II) で表される基のうち、 $A_r$  が単結合であり、 $A$  がメチレン基であり、 $R^1$  が  $-(CH_2)_3-G^3-S(O)_2-Z$  であり、 $R^a$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒に  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合である化合物 (117)、並びに一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が水素原子であり、 $X^2$  が、 $\alpha$  配置の、一般式 (II)
- 10  $)$  で表される基であり、かつその一般式 (II) で表される基のうち、 $A_r$  が単結合であり、 $A$  がメチレン基であり、 $R^1$  が  $-(CH_2)_3-G^3-S(O)_2-Z$  であり、 $R^a$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒に  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合である化合物 (118) を製造する方法である。



第N3工程は、化合物(112)を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物(108)と化合物(257)を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A4工程と同様に行われる。

第N5工程は、化合物(113)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行われる。

第N6工程は、化合物(114)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成される。

使用される溶媒は、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール、*i*-プロパノール、*n*-ブタノール、*s*-ブタノール、*t*-ブタノール、ペンタノール、ヘキサノール、シクロプロパノール、シクロブタノール、シクロペンタノール、シクロヘキサノール、エチレングリコール、1,3-プロパンジオール、1,4-ブタンジオール、1,5-ペンタンジオールのようなアルコール系溶媒、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、

シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、酢酸エチル、アセトニトリル、ニトロメタンであり得、好適には、メタノール、エタノール等である。

- 5 接触還元を用いる条件は、水素-クロロトリス（トリフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-クロロトリス（トリパラトリルホスフィン）ロジウム（I）、水素-クロロトリス（トリパラメトキシフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-ヒドリドカルボニルトリス（トリフェニルホスフィン）ロジウム（I）、水素-酢酸ロジウム（II）、水素-酢酸ルテニウム（II）、水素-クロロヒドリドトリス（トリフェニルホスフィン）ルテニウム（II）、水素-カルボキシラトヒドリドトリス（トリフェニルホスフィン）ルテニウム（II）、水素-ヒドリドカルボニルトリス（トリフェニルホスフィン）イリジウム（I）、水素-白金（II）-塩化スズ錯体、水素-ペンタシアノコバルト（II）錯体、水素-トリシアノビピリジンコバルト（II）錯体、水素-ビス（ジメチルグリオキシマト）コバルト（II）錯体、水素-安息香酸メチル-トリカルボニルクロム錯体、水素-ビス（トリカルボニルシクロペンタジエニルクロム）、水素-ペンタカルボニル鉄、水素-ビス（シクロペンタジエニル）ジカルボニルチタン、水素-ヒドリドカルボニルコバルト錯体、水素-オクタカルボニルニコバルト、水素-ヒドリドカルボニルロジウム、水素-クロム（III）アセチルアセトナート-トリイソブチルアルミニウム、水素-コバルト（II）アセチルアセトナート-トリイソブチルアルミニウム、水素-ニッケル（II）-2-ヘキサノアート-トリエチルアルミニウム等の均一系、水素-二酸化白金、水素-白金/炭素、水素-パラジウム/炭素、水素-パラジウム/硫酸バリウム、水素-パラジウム/炭酸カルシウム、水素-ラネ-ニッケル、水素-カッパークロマイト、水素-ロジウム/炭素、水素-ロジウム/アルミナ、水素-二酸化ルテニウム、水素-ルテニウム/炭素等の不均一系条件であり得、好ましくは、水素-パラジウム/炭素等である。
- 10
- 15
- 20
- 25

反応温度は、通常0℃～100℃であり、好適には0℃～60℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、10分間～24時間であり、好適に



は10分間～6時間である。

第N7工程は、化合物(113)のR<sup>2</sup>におけるQ<sup>4</sup>が-S-である場合、化合物(115)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(113)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる

5

第N8工程は、化合物(113)のR<sup>2</sup>におけるQ<sup>4</sup>が-S-である場合、化合物(116)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(113)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる

。

10 第N9工程は、化合物(114)のR<sup>2</sup>におけるQ<sup>4</sup>が-S-である場合、化合物(117)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(114)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる

。

15 第N10工程は、化合物(114)のR<sup>2</sup>におけるQ<sup>4</sup>が-S-である場合、化合物(118)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(114)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

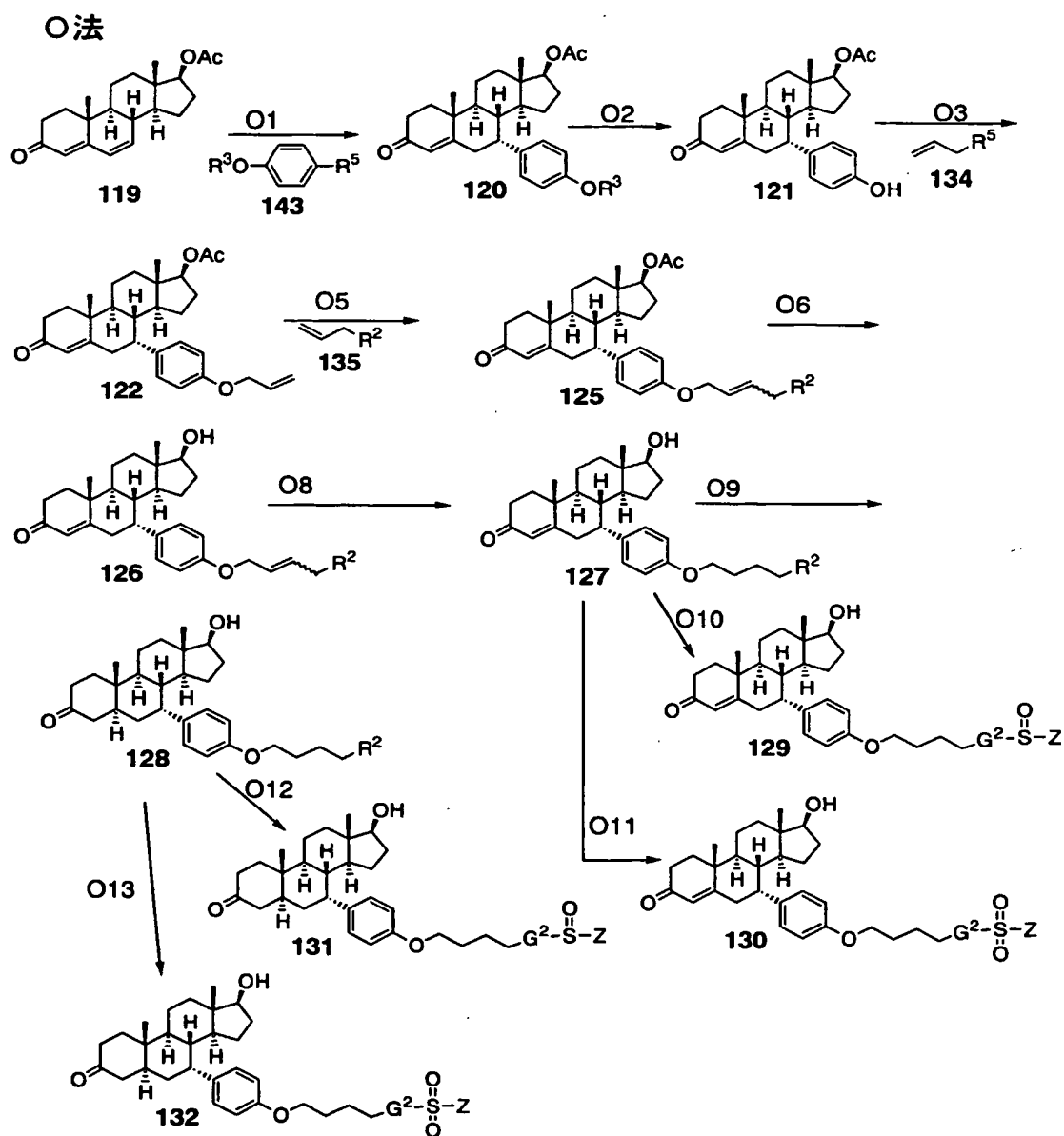
20 第N11工程は、化合物(114)を製造する別の工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記N法第N6工程と同様に行なわれる。

25 O法は、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が水素原子であり、X<sup>2</sup>が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、Arが芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、Aが-O-であり、R<sup>1</sup>が-CH<sub>2</sub>-CH=CH-CH<sub>2</sub>-R<sup>2</sup>であり、R<sup>3</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒になつて-(C=O)-であり、破線が実線と共に二重結合である化合物(126)、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が水素原子であり、X<sup>2</sup>が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、Arが芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、Aが-

- O-であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4-R^2$ であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に二重結合である化合物(127)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4-R^2$ であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物(128)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4-G^2-S(O)-Z$ であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に二重結合である化合物(129)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4-G^2-S(O)_2-Z$ であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に二重結合である化合物(130)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4-G^2-S(O)-Z$ であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物(131)、並びに一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が $-O-$

であり、 $R^1$ が $-(CH_2)_4-G^2-S(O)_2-Z$ であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物(132)を製造する方法である。

5



第○1工程は、化合物(120)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(

1 4 3) と金属 (好適には、マグネシウム) 又はアルキルリチウム (好適には、  
t-ブチルリチウム) を反応させることにより得られる化合物 (1 4 3) の反応  
性誘導体を、不活性溶媒中、添加剤 (好適には、テトラキス [ヨウ化 (トリ-  
n-ブチルホスフィン) 銅 (I)] ) の存在下、化合物 (1 1 9) と反応させるこ  
5 とにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しなければ、特に限定されないが、好適  
には、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのような  
エーテル類であり、更に好ましくは、エーテルである。反応温度は、溶媒の種類  
等により異なるが、通常、 $-78^{\circ}\text{C} \sim 80^{\circ}\text{C}$  (好適には、 $-78^{\circ}\text{C} \sim 50^{\circ}\text{C}$ ) で  
10 ある。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間 (好適  
には、30分間～15時間) である。

また、化合物 (1 2 0) を製造する際に副生する、化合物 (1 2 0) の7位の  
 $-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OR}^3$  が  $\beta$  配置である化合物を化合物 (1 2 0) の代わりに用いること  
により、化合物 (1 2 6)、化合物 (1 2 7)、化合物 (1 2 8)、化合物 (1  
15 2 9)、化合物 (1 3 0)、化合物 (1 3 1)、及び化合物 (1 3 2) の  $\text{X}^2$  が  $\beta$   
配置である化合物を得ることができる。

第02工程は、化合物 (1 2 1) を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物 (1  
2 0) と脱保護剤を反応させること、すなわち置換シリル基を除去することによ  
り達成される。

20 使用される不活性溶媒は、反応を阻害しないものであれば、特に限定されない  
が、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン  
のようなエーテル系溶媒、ジメチルホルムアミド、水であり、好適には、テトラ  
ヒドロフラン等である。使用される脱保護剤は、特に限定されないが、例えば、フ  
ッ化水素、フッ化水素-ピリジン、フッ化ナトリウム、フッ化カリウム、フッ化  
25 テトラ- $n$ -ブチルアンモニウムのようなフッ化物、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化  
水素酸、硫酸、リン酸のような無機酸、蟻酸、酢酸、p-トルエンスルホン酸の  
ような有機酸であり、好ましくは、フッ化テトラ- $n$ -ブチルアンモニウム等  
である。

反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $0^{\circ}\text{C} \sim 80^{\circ}\text{C}$  (好適には、

0℃～50℃)である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間(好適には、30分間～15時間)である。

第○3工程は、化合物(122)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(121)に塩基を反応させることにより得られる化合物(121)の塩を、不活性溶媒中、化合物(134)と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A3工程と同様に行われる。

第○5工程は、化合物(125)を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物(122)と化合物(135)を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A4工程と同様に行われる。

第○6工程は、化合物(126)を製造する工程で、水又は水溶性溶媒中、塩基又は酸(好適には、塩基)の存在下、化合物(125)を加水分解することにより達成される。

使用される水溶性溶媒は、特に限定されないが、例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、i-プロパノールのようなアルコール系溶媒、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル系溶媒、ジメチルホルムアミド等であり、好適には、メタノール等である。

使用される塩基は、特に限定されないが、例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化バリウム、水酸化セシウムのような金属水酸化物、炭酸カリウム、炭酸ナトリウムのような炭酸塩であり、好適には、水酸化ナトリウム等である。

使用される酸は、特に限定されないが、例えば、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、リン酸のような無機酸であり、好適には、塩酸等である。

反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、0℃～100℃(好適には、0℃～80℃)である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間(好適には、30分間～15時間)である。

第○8工程は、化合物(127)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行われる。

第○9工程は、化合物(128)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは

は不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記N法第N 6工程と同様に行われる。

5 第O10工程は、化合物(127)のR<sup>2</sup>におけるQ<sup>2</sup>が-S-である場合、化合物(129)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(127)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる。

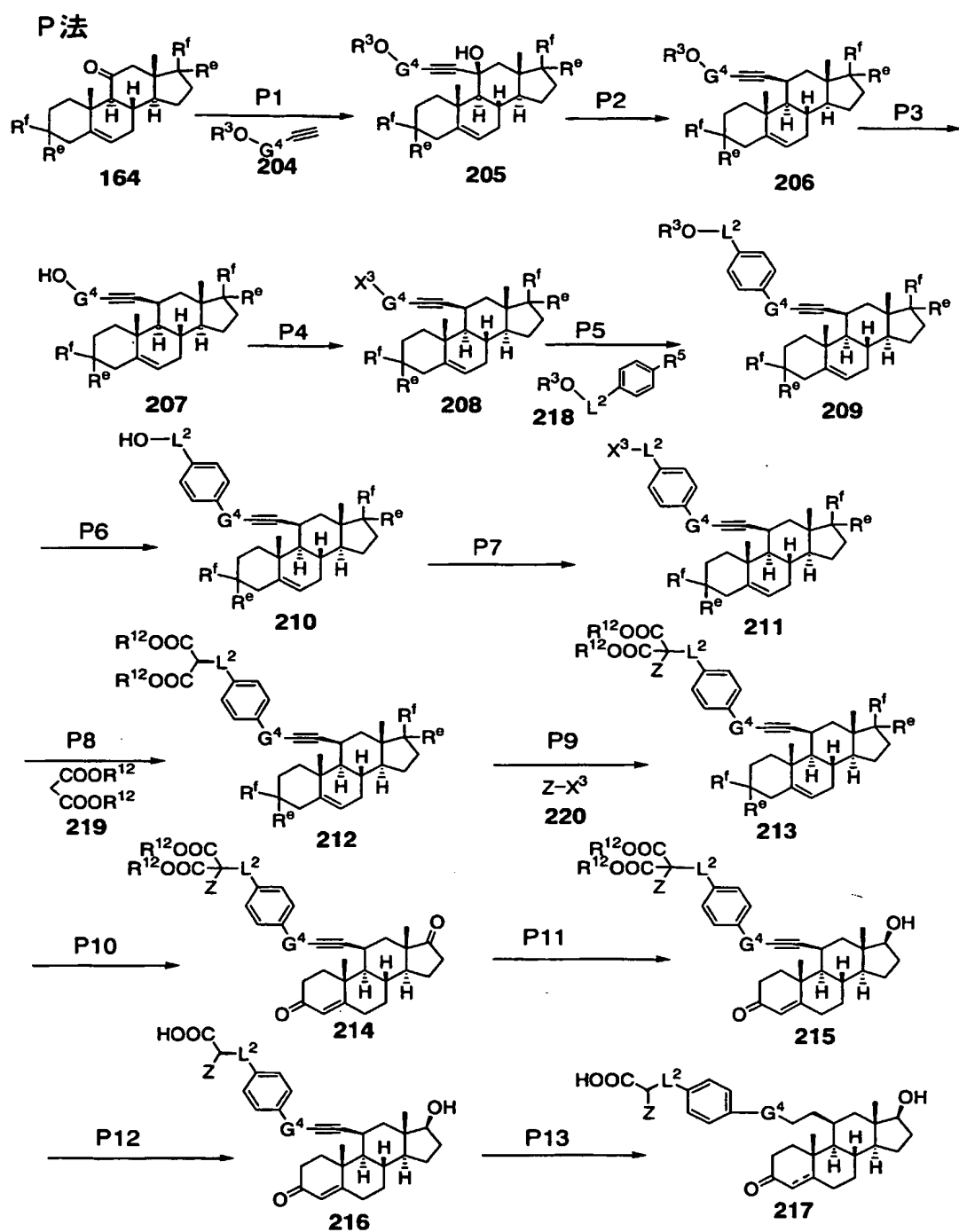
10 第O11工程は、化合物(127)のR<sup>2</sup>におけるQ<sup>2</sup>が-S-である場合、化合物(130)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(127)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

第O12工程は、化合物(128)のR<sup>2</sup>におけるQ<sup>2</sup>が-S-である場合、化合物(131)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(128)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる。

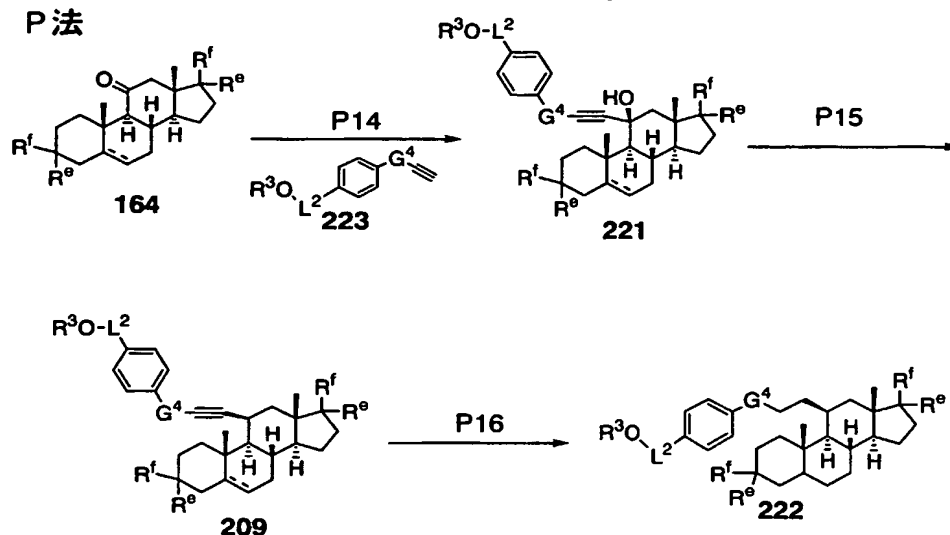
15 第O13工程は、化合物(128)のR<sup>2</sup>におけるQ<sup>2</sup>が-S-である場合、化合物(132)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(128)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

20 P法は、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>2</sup>が水素原子であり、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aがメチレン基であり、R<sup>1</sup>が一般式(III)で表される基であり、かつその一般式(III)で表される基のうち、Gが-G<sup>4</sup>-CH<sub>2</sub>-であり、Eが単結合であり、Jが置換されていてもよい芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、Yが単結合であり、LがL<sup>2</sup>であり、QがQ<sup>17</sup>であり、Q<sup>17</sup>におけるR<sup>1</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(217)を製造する方法である。

25



## P 法 (つづき)



5 第P1工程は、化合物(205)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(204)とアルキルリチウム(好適には、*n*-ブチルリチウム)を反応させることにより得られる化合物(204)の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物(164)と反応させることにより達成され、本反応は、前記F法第F1工程と同様に行われる。

10 第P2工程は、化合物(206)を製造する工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物(205)を還元剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記F法第F2工程と同様に行われる。

また、この工程で副生する、化合物(206)の11位の置換基が $\alpha$ 配置である化合物を用いることにより、化合物(217)のX<sup>1</sup>が $\alpha$ 配置である化合物を得ることができる。

15 第P3工程は、化合物(207)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(206)と脱保護剤を反応させること、すなわち置換シリル基を除去することにより達成され、本反応は、前記F法第F3工程と同様に行なわれる。

第P4工程は、化合物(208)を製造する工程で、アミン系溶媒中、化合物(207)を塩化スルホニル化合物と反応させるか、あるいは、不活性溶媒中、



化合物（２０７）をハロゲン化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記Ｆ法第Ｆ４工程と同様に行なわれる。

第Ｐ５工程は、化合物（２０９）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（２１８）と金属（好適には、マグネシウム）又はアルキルリチウム（好適には、  
５    ｎ－ブチルリチウム）を反応させることにより得られる化合物（２１８）の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物（２０８）と反応させることにより達成され、本反応は、前記Ｉ法第Ｉ１工程と同様に行われる。

第Ｐ６工程は、化合物（２１０）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（２０９）と脱保護剤を反応させること、すなわち置換シリル基を除去することにより達成され、本反応は、前記Ｐ法第Ｐ３工程と同様に行なわれる。  
１０

第Ｐ７工程は、化合物（２１１）を製造する工程で、アミン系溶媒中、化合物（２１０）を塩化スルホニル化合物と反応させるか、あるいは、不活性溶媒中、化合物（２１０）をハロゲン化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記Ｐ法第Ｐ４工程と同様に行なわれる。

第Ｐ８工程は、化合物（２１２）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（２１９）と塩基を反応させることにより得られる化合物（２１９）の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物（２１１）と反応させることにより達成される。  
１５

使用される不活性溶媒は、本反応に関与しないものであれば特に限定しないが、例えば、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、Ｎ－メチルピロリドン等であり、好適にはテトラヒドロフランのようなエーテル系溶媒、ジメチルホルムアミド等である。使用される塩基は、例えばナトリウムアルコキシド、カリウムｔ－ブトキシドのような金属アルコキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウムのような金属水素化物、メチルリチウム、エチルリチウム、ｎ－ブチルリチウム、ｔ－ブチルリチウムのようなアルキルリチウム、ナトリウムアミド、カリウムビストリメチルシリルアミド、ナトリウムビストリメチルシリルアミド、リチウムジイソプロピルアミドのような金属アミド、炭酸セシウム、炭酸カ  
２０  
２５

リウム、炭酸ナトリウムのような炭酸塩等であり、好適には水素化ナトリウムのような金属水素化物、リチウムジイソプロピルアミドのような金属アミド、炭酸セシウムのような炭酸塩等である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $-78^{\circ}\text{C}\sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、好適には $0^{\circ}\text{C}\sim 30^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、  
5 反応温度等により異なるが、通常10分間～24時間であり、好適には30分間～15時間である。

第P9工程は、化合物(213)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(212)と塩基を反応させることにより得られる化合物(212)の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物(220)と反応させることにより達成され、本反  
10 応は、前記P法第P8工程と同様に行われる。

なお、本法において、Zが水素原子である場合、本工程は省略することができる。

第P10工程は、化合物(214)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(213)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記L'法第L'5  
15 工程と同様に行われる。

第P11工程は、化合物(215)を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(214)と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記L'法第L'6工程と同様に行われる。

第P12工程は、化合物(216)を製造する工程で、含水アルコールもしくは  
20 は不活性溶媒中、化合物(215)と、酸、塩基もしくは金属塩を反応させることにより達成される。

使用される溶媒は、反応を阻害するものでなければ特に限定されないが、例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、i-プロパノール、n-ブタノール、s-ブタノール、t-ブタノールのようなアルコール系溶媒と水との混合溶媒、ピリジンのようなアミン系溶媒、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセ  
25 タミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド等であり得、好適にはメタノールもしくはエタノールのようなアルコール系溶媒と水との混合溶媒、ジメチルスルホキシド等である。

使用される酸は、例えば、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、リン酸の

ような無機酸であり得、好適には、塩酸、臭化水素酸等である。

使用される塩基は、例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化バリウム、水酸化セシウムのような金属水酸化物であり得、好適には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等である。

使用される金属塩は、例えば、塩化リチウム、シアン化ナトリウム等であり得、好適には塩化リチウム等である。

反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、25℃～180℃であり、好適には40℃～150℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分間～24時間であり、好適には30分間～15時間である。

第P13工程は、化合物(217)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、化合物(216)の接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記F法第F8工程と同様に行われる。

また、破線が、実線と共に、二重結合を形成している場合、この反応に付随して、単結合に変換されることもある。

第P14工程及び第P15工程は、化合物(209)を製造する別の方法である。

第P14工程は、化合物(221)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(223)とアルキルリチウム(好適には、*n*-ブチルリチウム)を反応させることにより得られる化合物(223)の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物(164)と反応させることにより達成され、本反応は、前記P法第P1工程と同様に行われる。

第P15工程は、化合物(209)を製造する工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物(209)を還元剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記P法第P2工程と同様に行われる。

また、この工程で副生する、化合物(209)の11位の置換基が $\alpha$ 配置である化合物を用いることにより、化合物(217)のX<sup>1</sup>が $\alpha$ 配置である化合物を得ることができる。

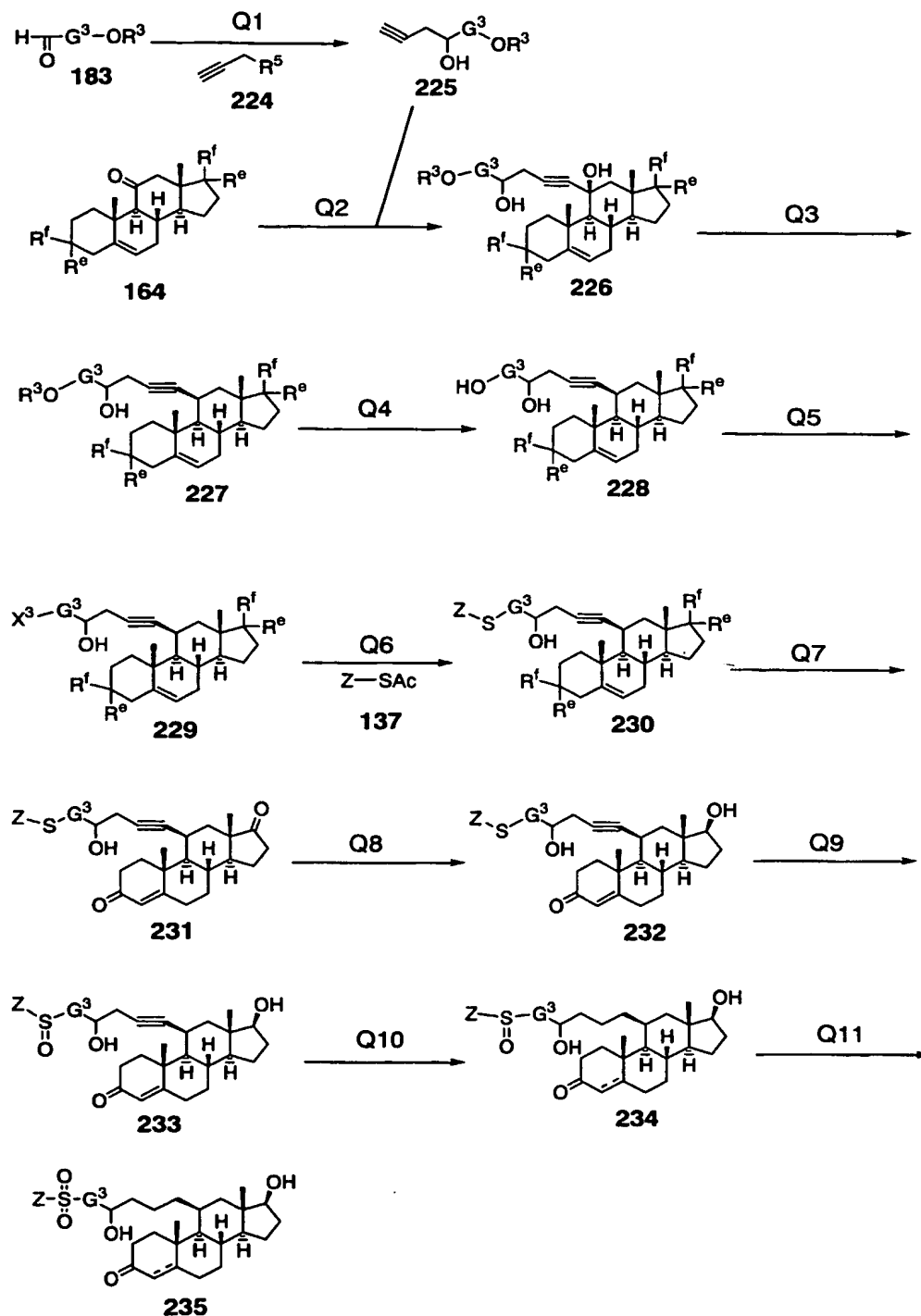
第P16工程は、化合物(222)を製造する工程で、アルコール系溶媒もし

くは不活性溶媒中、化合物（209）の接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記P法第P13工程と同様に行われる。

化合物（222）を、化合物（209）と同様に第P6工程に付すことにより、化合物（217）の破線が実線と共に単結合である化合物を製造することができる。

Q法は、一般式（I）で表される化合物のうち、 $X^2$ が水素原子であり、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式（II）で表される基であり、かつその一般式（II）で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が一般式（III）で表される基であり、かつその一般式（III）で表される基のうち、 $G$ が $-(CH_2)_2-CH(OH)-G^3-$ であり、 $E$ 、 $J$ 、 $Y$ 及び $L$ が単結合であり、 $Q$ が $Q^{63}$ であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物（234）並びに、一般式（I）で表される化合物のうち、 $X^2$ が水素原子であり、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式（II）で表される基であり、かつその一般式（II）で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が一般式（III）で表される基であり、かつその一般式（III）で表される基のうち、 $G$ が $-(CH_2)_2-CH(OH)-G^3-$ であり、 $E$ 、 $J$ 、 $Y$ 及び $L$ が単結合であり、 $Q$ が $Q^{64}$ であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物（235）を製造する方法である。

## Q法



第Q1工程は、化合物(225)を製造する工程で、添加物〔好適には、塩化水銀(I I)〕の存在下もしくは非存在下(好適には、存在下)、不活性溶媒中

、化合物（２２４）と金属（好適には、マグネシウム）又はアルキルリチウム（好適には、*t*-ブチルリチウム）を反応させることにより得られる化合物（２２４）の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物（１８３）と反応させることにより達成される。

- 5      使用される不活性溶媒は、反応に関与しなければ、特に限定されないが、好適には、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒等であり、更に好ましくは、エーテル、テトラヒドロフラン等である。

- 10      反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、０℃～８０℃（好適には、１０℃～５０℃）である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常１５分間～２４時間（好適には、３０分間～１５時間）である。

- 15      第Ｑ２工程は、化合物（２２６）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（２２５）とアルキルリチウム（好適には、*n*-ブチルリチウム）を反応させることにより得られる化合物（２２５）の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物（１６４）と反応させることにより達成され、本反応は、前記Ｆ法第Ｆ１工程と同様に行われる。

第Ｑ３工程は、化合物（２２７）を製造する工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物（２２６）を還元剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記Ｆ法第Ｆ２工程と同様に行われる。

- 20      また、この工程で副生する、化合物（２２７）の１１位の置換基が $\alpha$ 配置である化合物を用いることにより、化合物（２３４）及び化合物（２３５）の $X'$ が $\alpha$ 配置である化合物を得ることができる。

- 25      第Ｑ４工程は、化合物（２２８）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（２２７）と脱保護剤を反応させること、すなわち置換シリル基を除去することにより達成され、本反応は、前記Ｆ法第Ｆ３工程と同様に行なわれる。

第Ｑ５工程は、化合物（２２９）を製造する工程で、アミン系溶媒中、化合物（２２８）を塩化スルホニル化合物と反応させるか、あるいは、不活性溶媒中、化合物（２２８）をハロゲン化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記Ｆ法第Ｆ４工程と同様に行なわれる。

第Q 6工程は、化合物(2 3 0)を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物(1 3 7)と金属アルコキシドを反応させることにより得られる化合物(1 3 7)の反応性誘導体を、アルコール系溶媒中、化合物(2 2 9)と反応させることにより達成され、本反応は、前記F法第F 5工程と同様に行なわれる。

- 5 第Q 7工程は、化合物(2 3 1)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(2 3 0)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記P法第P 1 0工程と同様に行われる。

- 10 第Q 8工程は、化合物(2 3 2)を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物(2 3 1)と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記P法第P 1 1工程と同様に行われる。

第Q 9工程は、化合物(2 3 3)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(2 3 2)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記F法第F 6工程と同様に行われる。

- 15 第Q 1 0工程は、化合物(2 3 4)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、化合物(2 3 3)の接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記F法第F 8工程と同様に行われる。

また、破線が、実線と共に、二重結合を形成している場合、この反応に付随して、単結合に変換されることもある。

- 20 第Q 1 1工程は、化合物(2 3 5)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(2 3 4)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記B法第B 7工程と同様に行われる。

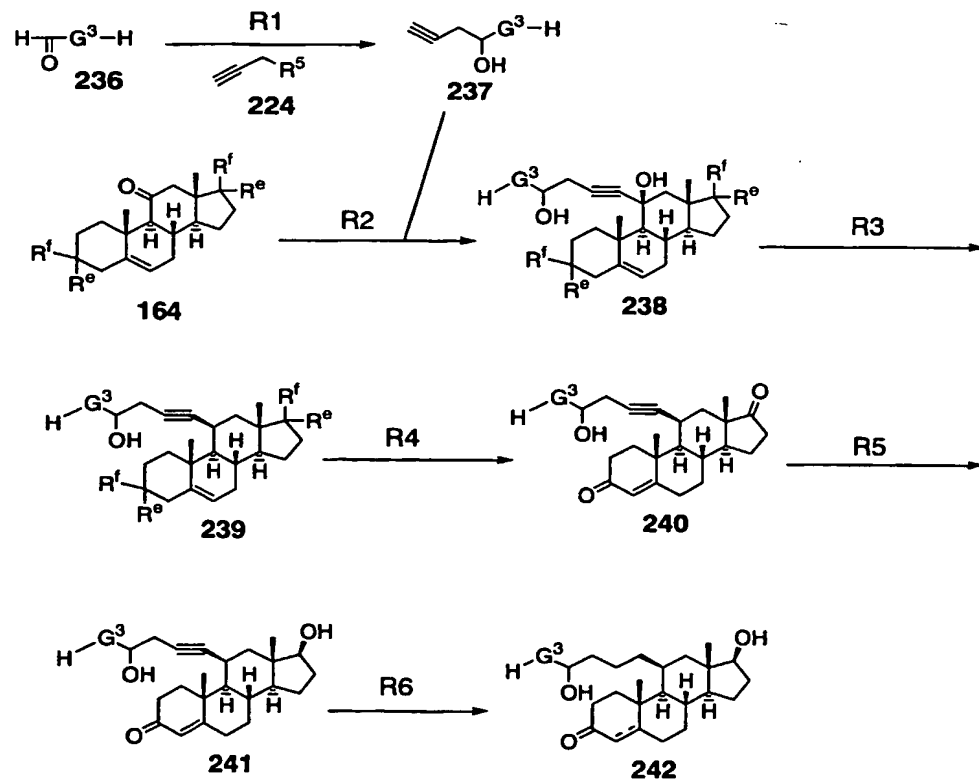
- 25 なお、本法において、第Q 5工程、第Q 6工程、第Q 9工程及び第Q 1 1工程を省略することにより、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^2$ が水素原子であり、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が一般式(III)で表される基であり、かつその一般式(III)で表される基のうち、 $G$ が $-(CH_2)_2-CH(OH)-G^3-$ であり、 $E$ 、 $J$ 、 $Y$ 、 $L$ 及び $Q$ が単結合であり、 $Z$ が $-O-R^d$ であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破

線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物も製造することができる。

さらに、本法において、G上の水酸基は、必要に応じて、任意の工程で、保護反応及び脱保護反応に付することができる。

R法は、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>2</sup>が水素原子であり、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aがメチレン基であり、R<sup>1</sup>が一般式(III)で表される基であり、かつその一般式(III)で表される基のうち、Gが-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CH(OH)-G<sup>3</sup>-であり、E、J、Y、L及びQが単結合であり、Zが水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に- (C=O) -であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(242)を製造する方法である。

#### R法



第R1工程は、化合物(237)を製造する工程で、添加物(好適には、塩化



水銀 (I I) } の存在下もしくは非存在下 (好適には、存在下)、不活性溶媒中、化合物 (2 2 4) と金属 (好適には、マグネシウム) 又はアルキルリチウム (好適には、*t*-ブチルリチウム) を反応させることにより得られる化合物 (2 2 4) の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物 (2 3 6) と反応させることにより達成され、本工程は、前記Q法第Q 1 工程と同様に行なわれる。

第R 2 工程は、化合物 (2 3 8) を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物 (2 3 7) とアルキルリチウム (好適には、*n*-ブチルリチウム) を反応させることにより得られる化合物 (2 3 7) の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物 (1 6 4) と反応させることにより達成され、本反応は、前記Q法第Q 2 工程と同様に行われる。

第R 3 工程は、化合物 (2 3 9) を製造する工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物 (2 3 8) を還元剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記Q法第Q 3 工程と同様に行われる。

また、この工程で副生する、化合物 (2 3 9) の1 1 位の置換基が $\alpha$ 配置である化合物を用いることにより、化合物 (2 4 2) のX'が $\alpha$ 配置である化合物を得ることができる。

第R 4 工程は、化合物 (2 4 0) を製造する工程で、水系溶媒中、化合物 (2 3 9) を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記Q法第Q 7 工程と同様に行われる。

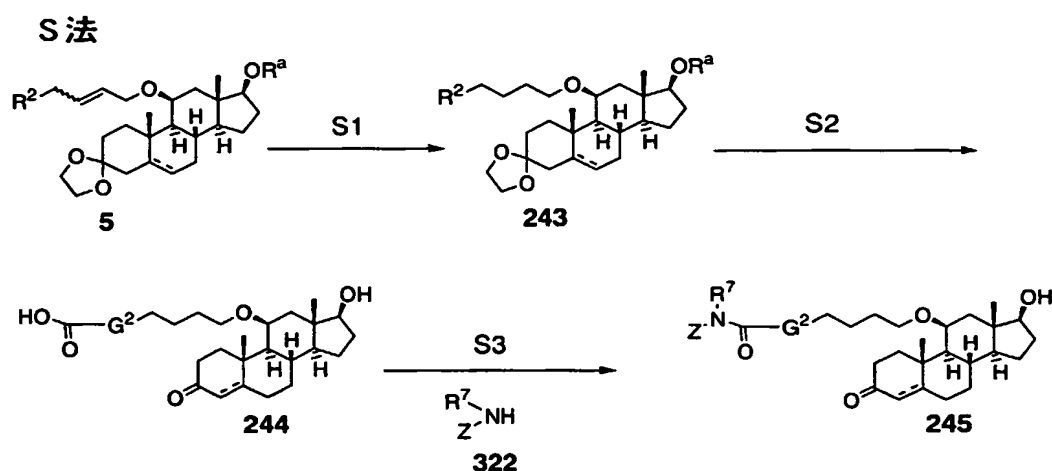
第R 5 工程は、化合物 (2 4 1) を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、化合物 (2 4 0) と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記Q法第Q 8 工程と同様に行われる。

第R 6 工程は、化合物 (2 4 2) を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、化合物 (2 4 1) の接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記Q法第Q 1 0 工程と同様に行われる。

また、破線が、実線と共に、二重結合を形成している場合、この反応に付随して、単結合に変換されることもある。

なお、本法において、G上の水酸基は、必要に応じて、任意の工程で、保護反応及び脱保護反応に付すことができる。

S法は、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(I I)で表される基であり、かつその一般式(I I)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-G^2-COOH$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(244)、及び、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(I I)で表される基であり、かつその一般式(I I)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-G^2-CON(R^7)Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(245)を製造する方法である。



15

第S1工程は、化合物(243)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行われる。

第S2工程は、化合物(243)の $R^2$ における $Q^2$ が $Q^{17}$ であり、 $Z$ が水素原子である場合、化合物(244)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(243)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A5工程

と同様に行われる。

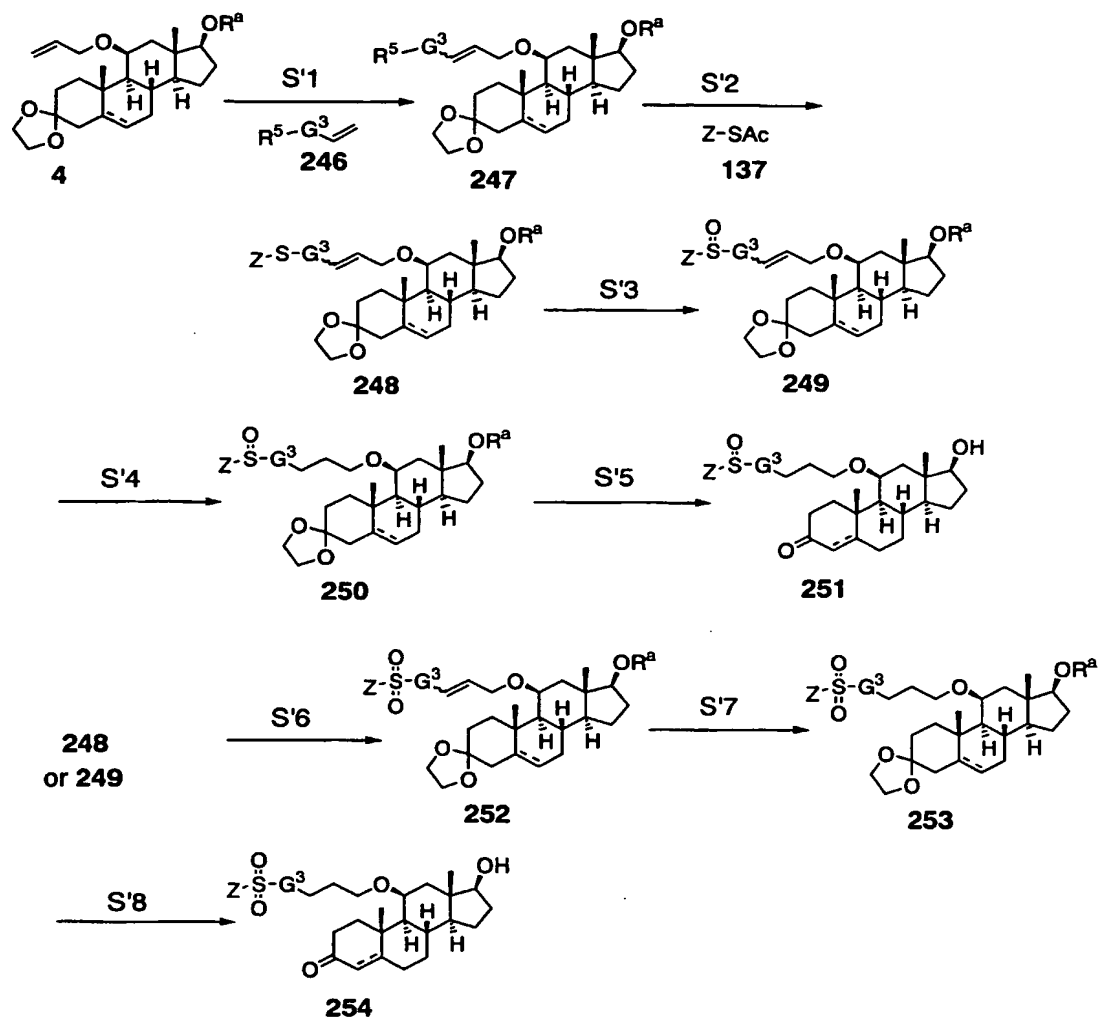
第S 3工程は、化合物(2 4 5)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(2 4 4)又はその反応性誘導体(酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類)と、化合物(3 2 2)又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、

5 本反応は、前記C法第C 3工程と同様に行われる。

S法において、第S 2工程→第S 3工程→第S 1工程、もしくは、第S 2工程→第S 1工程→第S 3工程の順に反応を行なっても化合物(2 4 5)を製造することができる。

S'法は、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(I I)で表される基であり、かつその一般式(I I)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-CH_2-CH_2-CH_2-G^3-SO-Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(2 5 1)、及び、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(I I)で表される基であり、かつその一般式(I I)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-CH_2-CH_2-CH_2-G^3-SO_2-Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(2 5 4)を製造する方法である。

## S' 法



第S' 1工程は、化合物（247）を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物（4）と化合物（246）を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A 4工程と同様に行われる。

第S' 2工程は、化合物（248）を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物（137）と金属アルコキシドを反応させることにより得られる化合物（137）の反応性誘導体を、アルコール系溶媒中、化合物（247）と反応させることにより達成され、本反応は、前記B法第B 4工程と同様に行われる。

第S' 3工程は、化合物（249）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（248）を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A

8工程と同様に行われる。

第S' 4工程は、化合物(250)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A 6工程と同様に行われる。

- 5 第S' 5工程は、化合物(251)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(250)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A 5工程と同様に行われる。

- 第S' 6工程は、化合物(252)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(248)又は化合物(249)を酸化剤と反応させることにより達成され、本  
10 反応は、前記A法第A 9工程と同様に行われる。

第S' 7工程は、化合物(253)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A 6工程と同様に行われる。

また、本工程は、化合物(250)を出発原料として用いても達成される。

- 15 第S' 8工程は、化合物(254)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(253)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A 5工程と同様に行われる。

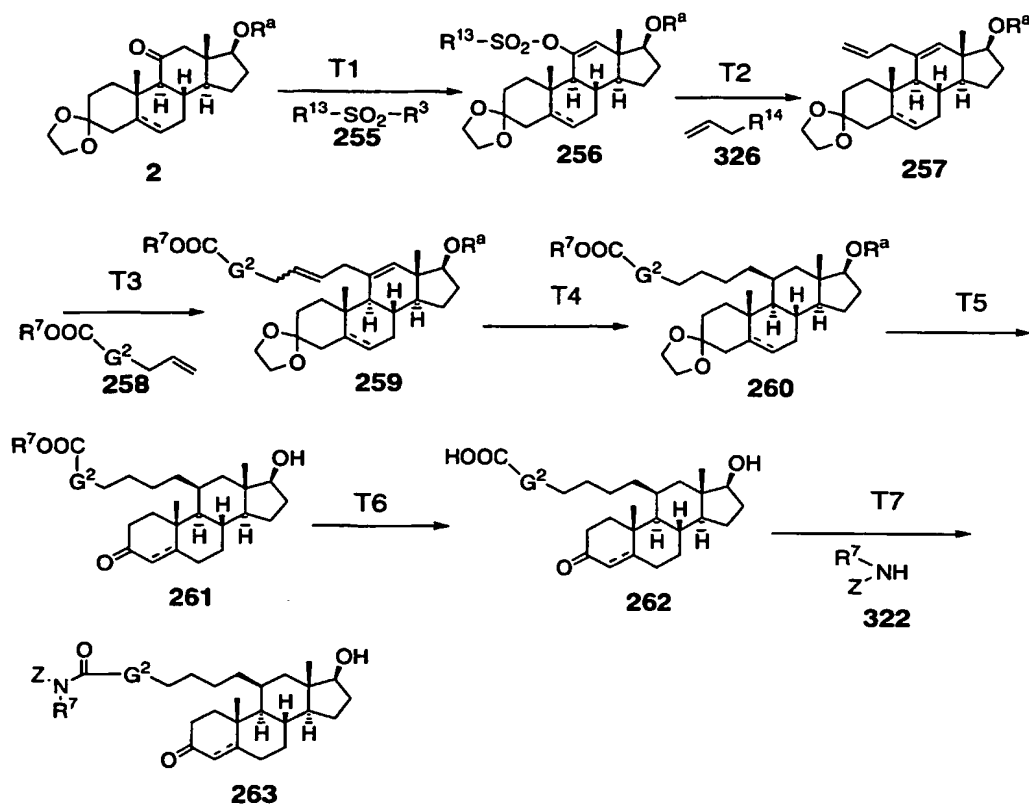
また、本工程は、化合物(251)を出発原料として用いても達成される。

- S' 法において、化合物(247)より、第S' 4工程→第S' 2工程→第S'  
20 ' 5工程→第S' 3工程、第S' 5工程→第S' 4工程→第S' 2工程→第S' 3工程、第S' 4工程→第S' 5工程→第S' 2工程→第S' 3工程、もしくは、第S' 5工程→第S' 2工程→第S' 3工程→第S' 4工程の順に反応を行なっても化合物(251)を製造することができる。さらに、化合物(247)より、第S' 4工程→第S' 2工程→第S' 5工程→第S' 6工程、第S' 5工程  
25 →第S' 4工程→第S' 2工程→第S' 6工程、第S' 4工程→第S' 5工程→第S' 2工程→第S' 6工程、もしくは、第S' 5工程→第S' 2工程→第S' 6工程→第S' 4工程の順に反応を行なっても化合物(254)を製造することができる。

T法は、一般式(I)で表される化合物のうち、X'が、β配置の、一般式(I

- I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、A r が単結合であり、A がメチレン基であり、R<sup>1</sup>が  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{G}^2-\text{COO}$  R<sup>1</sup>であり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒に  $-(\text{C}=\text{O})-$  であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (2 6 1)、一般式 (I) で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、 $\beta$  配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、A r が単結合であり、A がメチレン基であり、R<sup>1</sup>が  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{G}^2-\text{COOH}$  であり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒に  $-(\text{C}=\text{O})-$  であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (2 6 2)、及び、一般式 (I) で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、 $\beta$  配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、A r が単結合であり、A がメチレン基であり、R<sup>1</sup>が  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{G}^2-\text{CON}(\text{R}^1)-\text{Z}$  であり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒に  $-(\text{C}=\text{O})-$  であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (2 6 3) を製造する方法である。

## T法



第T1工程は、化合物（256）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（2）に塩基を反応させることにより得られる化合物（2）の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物（255）と反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しないものであれば特に限定されないが、好適にはエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒等であり、さらに好適にはテトラヒドロフラン等である。使用される塩基は、好適には、*n*-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド等である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $-100^{\circ}C \sim 50^{\circ}C$ であり、好適には $-78^{\circ}C \sim 30^{\circ}C$ である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分間～48時間であり、好適には30分間～24時間である。

第T2工程は、化合物（257）を製造する工程で、不活性溶媒中、金属触媒存在下、化合物（256）を化合物（326）と反応させることにより達成され

る。

使用される不活性溶媒は、反応に関与しないものであれば特に限定されないが、好適にはエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒等であり、さらに好適にはテトラヒドロフラン等である。使用される金属触媒は、特に限定されないが、例えば、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム、酢酸パラジウム（II）-トリフェニルホスフィン、塩化ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（II）等であり得、好適にはテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウムである。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、0℃～100℃であり、好適には10℃～80℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分間～48時間であり、好適には30分間～24時間である。

第T3工程は、化合物（259）を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物（257）と化合物（258）を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A4工程と同様に行われる。

第T4工程は、化合物（260）を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成される。

使用される溶媒は、メタノール、エタノール、n-プロパノール、i-プロパノール、n-ブタノール、s-ブタノール、t-ブタノール、ペンタノール、ヘキサノール、シクロプロパノール、シクロブタノール、シクロペンタノール、シクロヘキサノール、エチレングルコール、1,3-プロパンジオール、1,4-ブタンジオール、1,5-ペンタンジオールのようなアルコール系溶媒、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、酢酸エチル、アセトニトリル、ニトロメタンであり得、好適には、エタノール、ジオキサン、ベンゼン、酢酸エチル等である。

接触還元を用いる条件は、水素-クロロトリス（トリフェニルホスフィン）ロ



ジウム (I)、水素-クロロトリス (トリパラトリルホスフィン) ロジウム (I)、水素-クロロトリス (トリパラメトキシフェニルホスフィン) ロジウム (I)、水素-ヒドリドカルボニルトリス (トリフェニルホスフィン) ロジウム (I)、水素-酢酸ロジウム (I I)、水素-酢酸ルテニウム (I I)、水素-クロロヒドリドトリス (トリフェニルホスフィン) ルテニウム (I I)、水素-カルボキシラトヒドリドトリス (トリフェニルホスフィン) ルテニウム (I I)、水素-ヒドリドカルボニルトリス (トリフェニルホスフィン) イリジウム (I)、水素-白金 (I I) -塩化スズ錯体、水素-ペンタシアノコバルト (I I) 錯体、水素-トリシアノビピリジンコバルト (I I) 錯体、水素-ビス (ジメチルグリオキシマト) コバルト (I I) 錯体、水素-安息香酸メチル-トリカルボニルクロム錯体、水素-ビス (トリカルボニルシクロペンタジエニルクロム)、水素-ペンタカルボニル鉄、水素-ビス (シクロペンタジエニル) ジカルボニルチタン、水素-ヒドリドカルボニルコバルト錯体、水素-オクタカルボニルニコバルト、水素-ヒドリドカルボニルロジウム、水素-クロム (I I I) アセチルアセトナート-トリイソブチルアルミニウム、水素-コバルト (I I) アセチルアセトナート-トリイソブチルアルミニウム、水素-ニッケル (I I) -2-ヘキサノアート-トリエチルアルミニウム等の均一系、水素-二酸化白金、水素-白金/炭素、水素-パラジウム/炭素、水素-水酸化パラジウム/炭素、水素-パラジウム/硫酸バリウム、水素-パラジウム/炭酸カルシウム、水素-ラネ-ニッケル、水素-カッパークロマイト、水素-ロジウム/炭素、水素-ロジウム/アルミナ、水素-二酸化ルテニウム、水素-ルテニウム/炭素、水素-イリジウム黒等の不均一系条件であり得、好ましくは水素-イリジウム黒等である。

反応温度は、通常 0℃～100℃であり、好適には 0℃～60℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、10分間～100時間であり、好適には 10時間～96時間である。

第 T 5 工程は、化合物 (261) を製造する工程で、水系溶媒中、化合物 (260) を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記 A 法第 A 5 工程と同様に行われる。

本工程において、エステルが加水分解されることもあり、その場合はそのあと

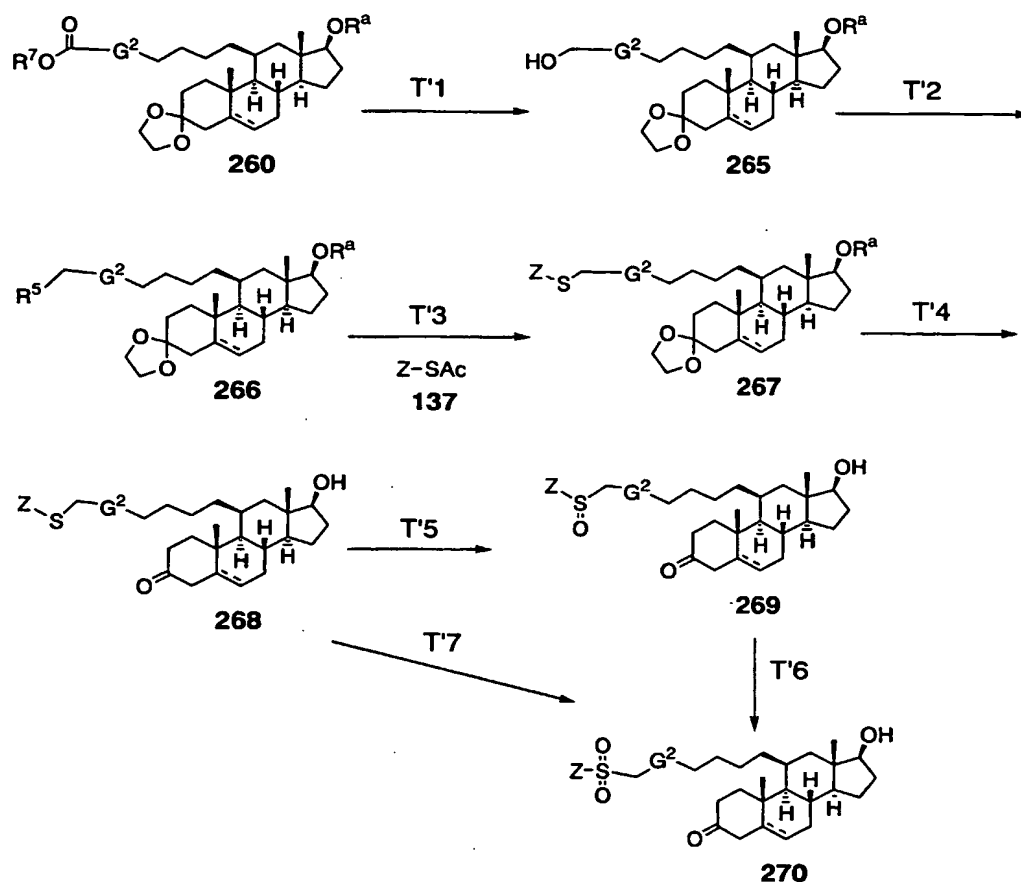
の第T 6工程を省略することができる。

第T 6工程は、化合物(2 6 2)を製造する工程で、水又は水溶性溶媒中、塩基又は酸(好適には、塩基)の存在下、化合物(2 6 1)を加水分解することにより達成され、本反応は、前記O法第O 6工程と同様に行われる。

- 5 第T 7工程は、化合物(2 6 3)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(2 6 2)又はその反応性誘導体(酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類)と、化合物(3 2 2)又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C 3工程と同様に行われる。

- T'法は、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式(I I)で表される基であり、かつその一般式(I I)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aがメチレン基であり、R<sup>1</sup>が-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-G<sup>2</sup>-CH<sub>2</sub>-S-Zであり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(2 6 8)、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式(I I)で表される基であり、かつその一般式(I I)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aがメチレン基であり、R<sup>1</sup>が-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-G<sup>2</sup>-CH<sub>2</sub>-SO-Zであり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(2 6 9)、及び、一般式(I)で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式(I I)で表される基であり、かつその一般式(I I)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aがメチレン基であり、R<sup>1</sup>が-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-G<sup>2</sup>-CH<sub>2</sub>-SO<sub>2</sub>-Zであり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(2 7 0)を製造する工程である。

## T' 法



第T' 1工程は、化合物（265）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物  
5 （260）と還元剤を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A  
2工程と同様に行われる。

第T' 2工程は、化合物（266）を製造する工程で、アミン系溶媒中、化合  
物（265）を塩化スルホニル化合物と反応させるか、あるいは、不活性溶媒中  
、化合物（265）をハロゲン化剤と反応させることにより達成され、本反応は  
10 、前記B法第B 3工程と同様に行われる。

第T' 3工程は、化合物（267）を製造する工程で、アルコール系溶媒中、  
化合物（137）と金属アルコキシドを反応させることにより得られる化合物（

137) の反応性誘導体を、アルコール系溶媒中、化合物(266) と反応させることにより達成され、本反応は、前記B法第B4工程と同様に行われる。

第T'4工程は、化合物(268) を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(267) を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A5工程  
5 と同様に行われる。

第T'5工程は、化合物(269) を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(268) を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる。

第T'6工程は、化合物(270) を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物  
10 (269) を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

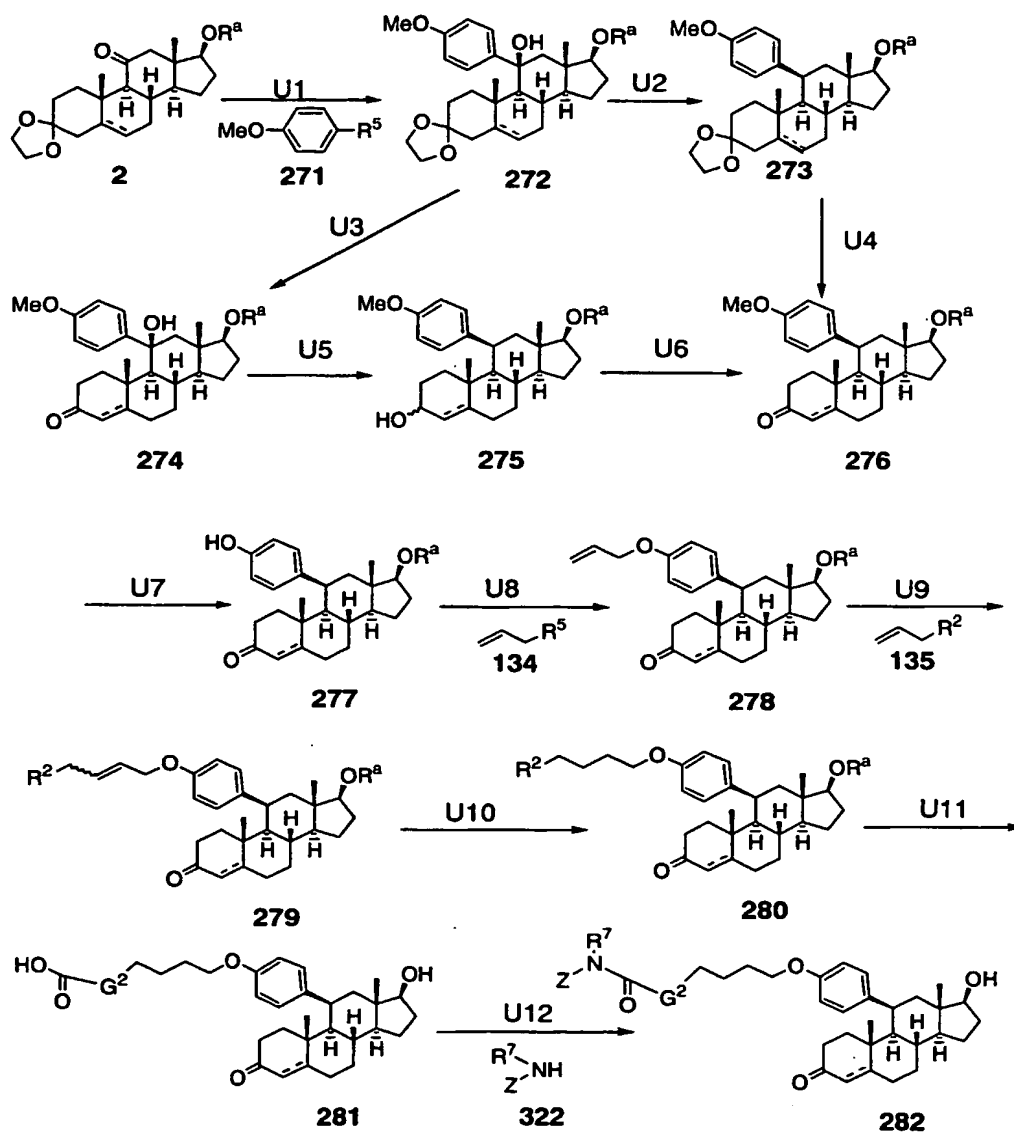
第T'7工程は、化合物(270) を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物(268) を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

15 T'法において、第T'3工程と第T'4工程の順番を入れ替えることもできる。また、第T'4工程と第T'5工程の順番を入れ替えることもできる。また、化合物(267) より、第T'6工程→第T'4工程の順に反応を行なっても、化合物(270) を得ることができる。

U法は、一般式(I) で表される化合物のうち、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式(I  
20 I) で表される基であり、かつその一般式(II) で表される基のうち、A<sub>r</sub>が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、Aが-O-であり、R<sup>1</sup>がメチル基であり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(276)、一般式(I) で表される化合物のうち  
25 、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式(II) で表される基であり、かつその一般式(II) で表される基のうち、A<sub>r</sub>が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、Aが-O-であり、R<sup>1</sup>が-CH<sub>2</sub>-CH=CH<sub>2</sub>であり、X<sup>2</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(27

- 8)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-CH_2-CH=CH-CH_2-R^2$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、  
5、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(279)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-R^2$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(280)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-G^2-COOH$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(281)、及び、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-G^2-CON(R^1)Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(282)を製造  
25 する方法である。

## U法



第U1工程は、化合物(272)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(271)と金属(好適には、マグネシウム)又はアルキルリチウム(好適には、 $n$ -ブチルリチウム)を反応させることにより得られる化合物(271)の反応性誘導体を、不活性溶媒中、化合物(2)と反応させることにより達成され、本反応は、前記I法第I1工程と同様に行なわれる。

第U2工程は、化合物(273)を製造する工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物(272)を還元剤と反応させることにより達成され、本反応は

、前記E法第E 2工程と同様に行われる。

第U 3工程は、化合物(274)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(272)を酸と反応させるとこにより達成される。

5 使用される溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定されないが、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル系溶媒、メタノール、エタノールのようなアルコール系溶媒又はアセトンのようなケトン系溶媒と水との混合溶媒であり得、好適には、含水アセトンである。

10 使用される酸は、例えば、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、リン酸のような無機酸、酢酸、p-トルエンスルホン酸、ピリジニウム-p-トルエンスルホネートのような有機酸であり得、好適には、塩酸である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、0℃～50℃(好適には、10℃～30℃)である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常15分間～24時間(好適には、30分間～5時間)である。

15 第U 4工程は、化合物(276)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(273)を酸と反応させるとこにより達成され、本工程は、前記U法第U 3工程と同様に行なわれる。

第U 5工程は、化合物(275)を製造する工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物(274)を還元剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記E法第E 2工程と同様に行われる。

20 第U 6工程は、化合物(276)を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物(275)を酸化剤と反応させることにより達成される。

25 使用される不活性溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定されないが、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような炭化水素系溶媒等であり得、好適にはジクロロメタン、テトラヒドロフラン等である。またこれらの溶媒に水を加えてもよい。使用される酸化剤は、特に限定されないが、例えば、過マンガン酸カリウム、二酸化マンガン、酢酸マンガン(I I I)、トリス(アセトニルアセトナイト)マンガン(I I I)(MTA)、硫

- 酸マンガン (I I I)、ピロリン酸マンガン (I I I) のようなマンガン化合物、酸化クロム (I V)、J o n e s 試薬、S a r e t t 試薬、C o l l i n s 試薬、クロム酸 t-ブチルエステル、重クロム酸カリウム、B e c k m a n n 混液、重クロム酸ナトリウム、K i l i a n i 試薬、塩化クロミル、酢酸クロミル、
- 5    ピリジニウムクロロクロメート (P C C)、ピリジニウムジクロメート (P D C) のようなクロム酸、四酸化ルテニウム、トリス (トリフェニルホスフィン) ジクロロルテニウム/ヨードシルベンゼン、トリス (トリフェニルホスフィン) ジクロロルテニウム/N-メチルモルホリン-N-オキシド、トリス (トリフェニルホスフィン) ジクロロルテニウム/t-ブチルヒドロペルオキシド、過ルテニウム酸テトラプロピルアンモニウム (T P A P)、過ルテニウム酸テトラプロピルアンモニウム (T P A P) / N-メチルモルホリン-N-オキシド、過ルテニウム酸テトラブチルアンモニウム (T B A P)、過ルテニウム酸テトラブチルアンモニウム (T B A P) / N-メチルモルホリン-N-オキシドのようなルテニウム化合物、次亜塩素酸、次亜塩素酸ナトリウム、次亜臭素酸カリウム、次亜ヨウ素酸カリウム、塩素酸ナトリウム、塩素酸カリウム、臭素酸ナトリウム、臭素酸カリウム、ヨウ素酸ナトリウム、ヨウ素酸カリウム、フッ化ペルクロリル、オルト過ヨウ素酸、メタ過ヨウ素酸ナトリウム、メタ過ヨウ素酸カリウム、N-ブ
- 10    ロモアセトアミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ブロモフタルイミドのようなハロゲン類、その他、ジメチルスルホキシド/塩化オキサリル等であり得、好適には、ピリジニウムクロロクロメート (P C C)、ピリジニウムジクロメート (P D C) のようなクロム酸、過ルテニウム酸テトラプロピルアンモニウム (T P A P) / N-メチルモルホリン-N-オキシドのようなルテニウム化合物である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、-30℃~100℃であり、好適には0℃~30℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分間~48時間であり、好適には30分間~24時間である。
- 20    25

第U7工程は、化合物 (277) を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物 (276) を脱保護剤と反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定されないが、例えばジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノ



ン、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等であり得、好適にはジメチルホルムアミド等である。使用される脱保護剤は、特に限定されないが、例えば、ナトリウムチオメトキシド、シアン化ナトリウム、ヨウ化トリメチルシラン、三臭化ホウ素、三塩化ホウ素、塩化リチウム等であり得、好適にはナトリウムチオメトキシド等である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $-80^{\circ}\text{C}$ ~ $200^{\circ}\text{C}$ であり、好適には $0^{\circ}\text{C}$ ~ $180^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分間~96時間であり、好適には30分間~48時間である。

第U8工程は、化合物(278)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(277)に塩基を反応させることにより得られる化合物(277)の塩を、不活性溶媒中、化合物(134)と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A3工程と同様に行われる。

第U9工程は、化合物(279)を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物(135)と化合物(278)を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A4工程と同様に行われる。

第U10工程は、化合物(280)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行われる。

第U11工程は、化合物(280)の $\text{R}^2$ が $\text{G}^2-\text{COOR}^1$ である場合、化合物(281)を製造する工程で、水系溶媒中、化合物(280)を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A5工程と同様に行われる。

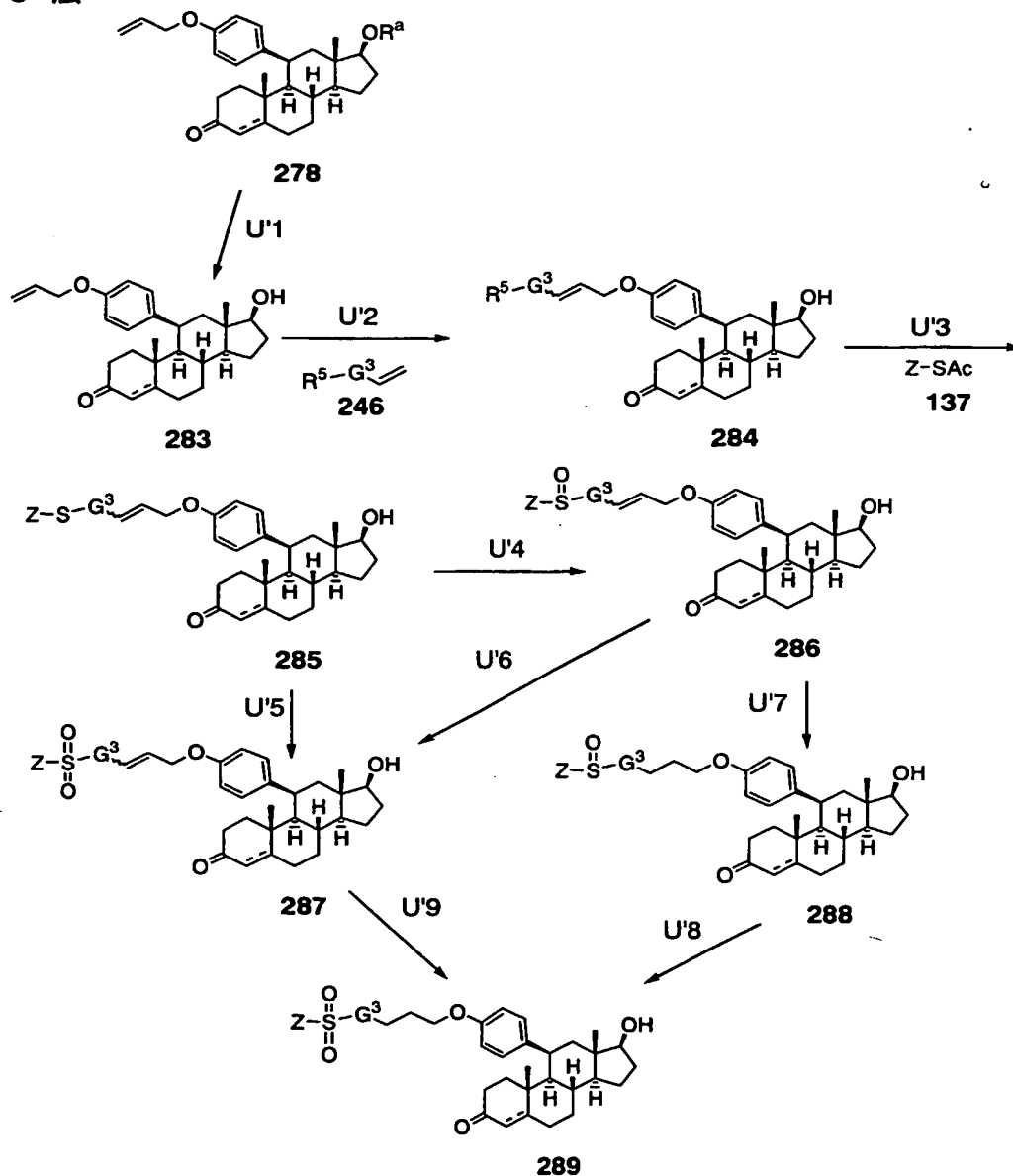
第U12工程は、化合物(282)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(281)又はその反応性誘導体(酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類)と、化合物(322)又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C3工程と同様に行われる。

U'法は、一般式(I)で表される化合物のうち、 $\text{X}^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $\text{Ar}$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $\text{A}$ が $-\text{O}-$ であり、 $\text{R}^1$ がアリル基であり、 $\text{X}^2$ が水素原子であり、 $\text{R}^3$ が水素原子であり、 $\text{R}^b$ 及び $\text{R}$

- は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒にあって  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (283)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が、 $\beta$  配置の、一般式 (II) で表される基であり、かつその一般式 (II) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは  $p$ -フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-CH_2-CH=C$
- 5  $H-G^3-R^5$  であり、 $X^2$  が水素原子であり、 $R^a$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒にあって  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (284)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が、 $\beta$  配置の、一般式 (II) で表される基であり、
- 10 かつその一般式 (II) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは  $p$ -フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-CH_2-CH=CH$   $-G^3-S-Z$  であり、 $X^2$  が水素原子であり、 $R^a$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒にあって  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (285)、一般式 (I)
- 15 で表される化合物のうち、 $X^1$  が、 $\beta$  配置の、一般式 (II) で表される基であり、かつその一般式 (II) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは  $p$ -フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-CH_2-CH=C$   $H-G^3-SO-Z$  であり、 $X^2$  が水素原子であり、 $R^a$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒にあって  $-(C=O)-$  であ
- 20 り、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (286)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が、 $\beta$  配置の、一般式 (II) で表される基であり、かつその一般式 (II) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは  $p$ -フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-CH_2-CH=$   $CH-G^3-SO_2-Z$  であり、 $X^2$  が水素原子であり、 $R^a$  が水素原子であり、 $R^b$
- 25 及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒にあって  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物 (287)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が、 $\beta$  配置の、一般式 (II) で表される基であり、かつその一般式 (II) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは  $p$ -フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-CH_2-C$

- $H_2-CH_2-G^3-SO-Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(288)、及び、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式(II)で
- 5 表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $Ar$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-CH_2-CH_2-CH_2-G^3-SO_2-Z$ であり、 $X^2$ が水素原子であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物(2
- 10 89)を製造する工程である。

U' 法



第U' 1工程は、化合物（283）を製造する工程で、水系溶媒中、化合物（278）を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A5工程と同様に行われる。

第U' 2工程は、化合物（284）を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物（246）と化合物（283）を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A4工程と同様に行われる。

第U' 3工程は、化合物(285)を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物(137)と金属アルコキシドを反応させることにより得られる化合物(137)の反応性誘導体を、アルコール系溶媒中、化合物(284)と反応させることにより達成され、本反応は、前記B法第B4工程と同様に行われる。

- 5 第U' 4工程は、化合物(286)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(285)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる。

- 10 第U' 5工程は、化合物(287)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(285)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

第U' 6工程は、化合物(287)を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物(286)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

- 15 第U' 7工程は、化合物(288)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行われる。

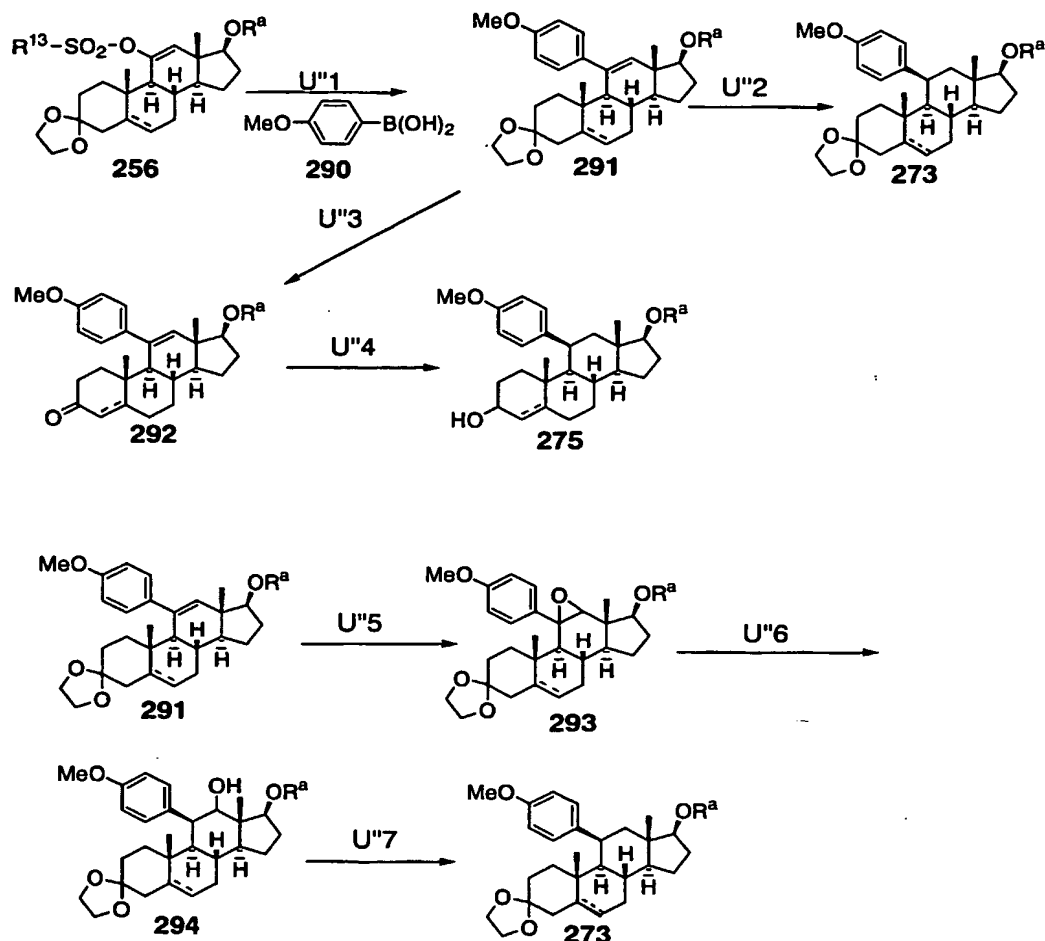
第U' 8工程は、化合物(289)を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物(288)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

- 20 第U' 9工程は、化合物(289)を製造する別の工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行われる。

- 25 U' 法において、化合物(284)より、第U' 7工程→第U' 3工程→第U' 4工程の順に反応を行なっても、化合物(288)を得ることができる。また、化合物(284)より、第U' 7工程→第U' 3工程→第U' 5工程の順に反応を行なっても、化合物(289)を得ることができる。

U' ' 法は、U' 法における化合物(273)及び(275)を製造する別の方法である。

## U'' 法



第U'' 1工程は、化合物（291）を製造する工程で、混合されていてもよい不活性溶媒中、金属触媒及び塩基の存在下、化合物（256）を化合物（290）と反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定されないが、例えば、ジオキサン、テトラヒドロフランのようなエーテル系溶媒、トルエンのような芳香族炭化水素系溶媒、エタノールのようなアルコール系溶媒、その他、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、アセトニトリル等であり得、好適には、ジオキサン、エタノール・トルエン等である。使用される金属触媒は、特に限定されないが、例えば、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム、酢酸パラジウム（II）-トリフェニルホスフィン、塩化ビス（トリフェ

ニルホスフィン) パラジウム (I I) 等であり得、好適にはテトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウムである。使用される塩基は、特に限定されないが、例えば、リン酸カリウム、炭酸ナトリウム等であり、好適には、炭酸ナトリウム等である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、0℃～180℃  
5 であり、好適には10℃～120℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分間～48時間であり、好適には30分間～24時間である。

第U' ' 2工程は、化合物 (273) を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成される。

使用される溶媒は、メタノール、エタノール、n-プロパノール、i-プロパノール、n-ブタノール、s-ブタノール、t-ブタノール、ペンタノール、ヘキサノール、シクロプロパノール、シクロブタノール、シクロペンタノール、シクロヘキサノール、エチレングルコール、1, 3-プロパンジオール、1, 4-ブタンジオール、1, 5-ペンタンジオールのようなアルコール系溶媒、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、キノリン、クロロベンゼンのような芳香族系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系溶媒、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセタミド、ジメチルイミダゾリジノン、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、酢酸エチル、アセトニトリル、ニトロメタンであり得、好適には、エタノール、ジオキサン、ベンゼン、酢酸エチル、アセトニトリル等である。  
10  
15  
20

接触還元を用いる条件は、水素-クロロトリス (トリフェニルホスフィン) ロジウム (I)、水素-クロロトリス (トリパラトリルホスフィン) ロジウム (I)、水素-クロロトリス (トリパラメトキシフェニルホスフィン) ロジウム (I)、水素-ヒドリドカルボニルトリス (トリフェニルホスフィン) ロジウム (I)、水素-酢酸ロジウム (I I)、水素-酢酸ルテニウム (I I)、水素-クロロヒドリドトリス (トリフェニルホスフィン) ルテニウム (I I)、水素-カルボキシラトヒドリドトリス (トリフェニルホスフィン) ルテニウム (I I)、水素-ヒドリドカルボニルトリス (トリフェニルホスフィン) イリジウム (I)、水素-白金 (I I) -塩化スズ錯体、水素-ペンタシアノコバルト (I I) 錯体  
25

- 、水素－トリシアノビピリジンコバルト（I I）錯体、水素－ビス（ジメチルグリオキシマト）コバルト（I I）錯体、水素－安息香酸メチル－トリカルボニルクロム錯体、水素－ビス（トリカルボニルシクロペンタジエニルクロム）、水素－ペンタカルボニル鉄、水素－ビス（シクロペンタジエニル）ジカルボニルチタン、水素－ヒドリドカルボニルコバルト錯体、水素－オクタカルボニルニコバルト、水素－ヒドリドカルボニルロジウム、水素－クロム（I I I）アセチルアセトナート－トリイソブチルアルミニウム、水素－コバルト（I I）アセチルアセトナート－トリイソブチルアルミニウム、水素－ニッケル（I I）－2－ヘキサノアート－トリエチルアルミニウム等の均一系、水素－二酸化白金、水素－白金／炭素、水素－パラジウム／炭素、水素－水酸化パラジウム／炭素、水素－パラジウム／硫酸バリウム、水素－パラジウム／炭酸カルシウム、水素－ラネーニッケル、水素－カッパークロマイト、水素－ロジウム／炭素、水素－ロジウム／アルミナ、水素－二酸化ルテニウム、水素－ルテニウム／炭素、水素－イリジウム黒等の不均一系条件であり得、好ましくは水素－水酸化パラジウム／炭素、水素－イリジウム黒等である。

反応温度は、通常0℃～100℃であり、好適には0℃～60℃である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常、10分間～100時間であり、好適には10時間～96時間である。

- 第U' ' 3工程は、化合物（292）を製造する工程で、水系溶媒中、化合物（291）を酸と反応させるとにより達成され、本工程は、前記U法第U3工程と同様に行なわれる。

第U' ' 4工程は、化合物（275）を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本工程は、前記U' ' 法第U' ' 2工程と同様に行なわれる。

- 第U' ' 5工程は、化合物（293）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（291）と酸化剤を反応させることにより、達成される。

使用される不活性溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定されないが、例えば、ジオキサン、テトラヒドロフランのようなエーテル系溶媒、トルエンのような芳香族炭化水素系溶媒、ジクロロメタンのようなハロゲン系系溶媒、そ



の他、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、アセトニトリル等であり得、好適には、ジクロロメタン等である。使用される酸化剤は、特に限定されないが、例えば、過安息香酸、メタクロロ過安息香酸、p-ニトロ過安息香酸、モノペルオキシフタル酸、過ギ酸、過酢酸、トリフルオロ過酢酸等であり得、好適には、メタクロロ過安息香酸等である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $-10^{\circ}\text{C}$ ～ $50^{\circ}\text{C}$ であり、好適には $0^{\circ}\text{C}$ ～ $30^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分間～48時間であり、好適には30分間～24時間である。

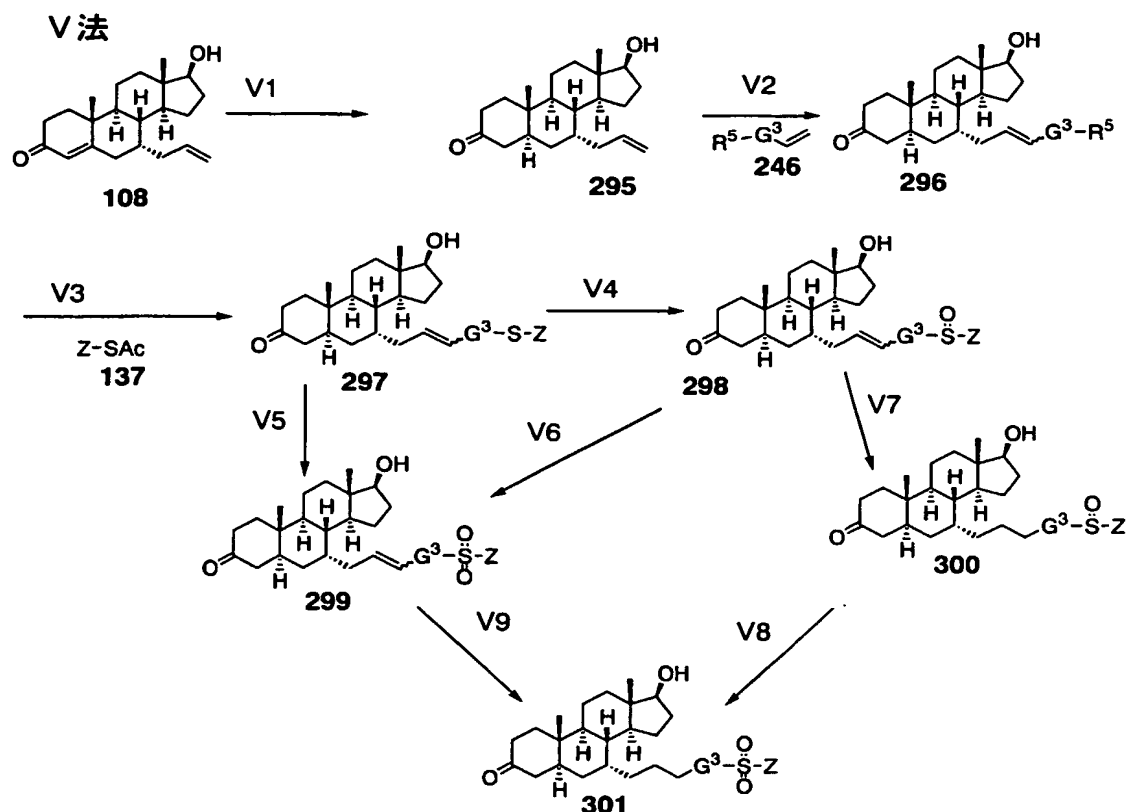
第U' ' 6工程は、化合物(294)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(293)を還元剤と反応させることにより達成される。

使用される不活性溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定されないが、例えば、テトラヒドロフランのようなエーテル系溶媒である。使用される還元剤は、例えば、ナトリウム/液体アンモニア、リチウム/液体アンモニア、リチウム/メチルアミン、リチウム/エチルアミン、リチウム/エチレンジアミン、ナトリウム/ヘキサメチルホスホアミド-*t*-ブタノール、ナトリウム/エタノール、ナトリウム/*t*-ブタノール-テトラヒドロフラン、ナトリウム/トルエン-*t*-アミルアルコール等であり得、好適には、ナトリウム/液体アンモニア等である。反応温度は、溶媒の種類等により異なるが、通常、 $-100^{\circ}\text{C}$ ～ $20^{\circ}\text{C}$ であり、好適には $-80^{\circ}\text{C}$ ～ $0^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、反応温度等により異なるが、通常10分間～24時間であり、好適には30分間～5時間である。

第U' ' 7工程は、化合物(273)を製造する別の工程で、不活性溶媒中、添加剤の存在下、化合物(294)を還元剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記E法第E2工程と同様に行なわれる。

V法は、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が $-\text{CH}=\text{CH}-\text{G}^3-\text{R}^5$ であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(\text{C}=\text{O})-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物(296)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子

- であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が $-\text{CH}=\text{CH}-\text{G}^3-\text{S}-\text{Z}$ であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(\text{C}=\text{O})-$ であり、破線が
- 5 実線と共に単結合である化合物 (297)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が $-\text{CH}=\text{CH}-\text{G}^3-\text{SO}-\text{Z}$ であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(\text{C}=\text{O})-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物 (298)、一般式 (I
- 10 ) で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が $-\text{CH}=\text{CH}-\text{G}^3-\text{SO}_2-\text{Z}$ であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(\text{C}=\text{O})-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物
- 15 (299)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{G}^3-\text{SO}-\text{Z}$ であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(\text{C}=\text{O})-$ であり、破線が実線と
- 20 共に単結合である化合物 (300)、及び、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{G}^3-\text{SO}_2-\text{Z}$ であり、 $R^a$ が水素原子で
- 25 あり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(\text{C}=\text{O})-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物 (301) を製造する方法である。



第V1工程は、化合物（295）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（108）を還元剤と反応させることにより達成され、本工程は、前記U' 法第5 U' 6工程と同様に行なわれる。

第V2工程は、化合物（296）を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物（246）と化合物（295）を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A4工程と同様に行われる。

第V3工程は、化合物（297）を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物（137）と金属アルコキシドを反応させることにより得られる化合物（137）の反応性誘導体を、アルコール系溶媒中、化合物（296）と反応させることにより達成され、本反応は、前記B法第B4工程と同様に行われる。

第V4工程は、化合物（298）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（297）を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる。

第V5工程は、化合物（299）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（

297) を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

第V6工程は、化合物(299)を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物(298)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

第V7工程は、化合物(300)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行われる。

第V8工程は、化合物(301)を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物(300)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

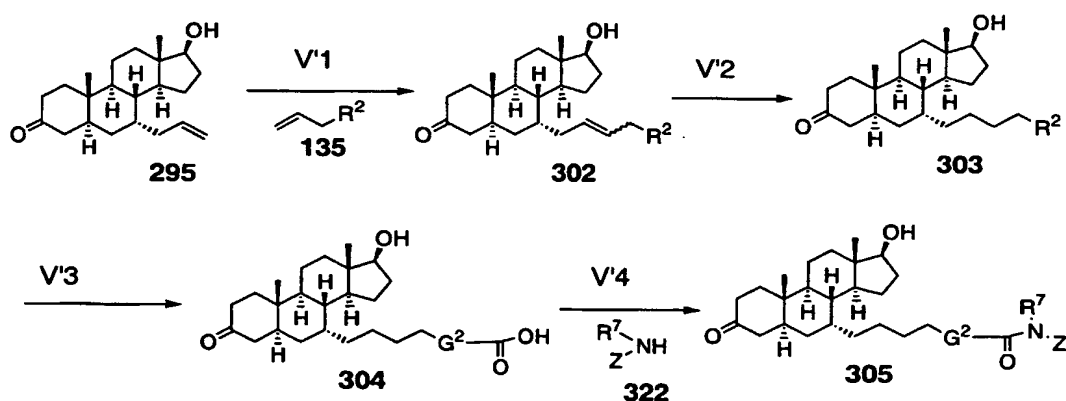
第V9工程は、化合物(301)を製造する別の工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行われる。

V法において、化合物(296)より、第V7工程→第V3工程→第V4工程の順に反応を行なっても、化合物(300)を得ることができる。また、化合物(296)より、第V7工程→第V3工程→第V5工程の順に反応を行なっても、化合物(301)を得ることができる。

V'法は、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aがメチレン基であり、 $R^1$ が $-CH=CH-CH_2-R^2$ であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物(302)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、Arが単結合であり、Aがメチレン基であり、 $R^1$ が $-CH_2-CH_2-CH_2-R^2$ であり、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物(303)、一般式(I)で表される化合物

- のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{G}^2-\text{COOH}$ であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に  
 5 なって $-(\text{C}=\text{O})-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物 (304)、及び、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$ が単結合であり、 $A$ がメチレン基であり、 $R^1$ が $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{G}^2-\text{CON}(\text{R}^7)\text{Z}$ であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、  
 10 それらが結合している3位の炭素原子と一緒になって $-(\text{C}=\text{O})-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物 (305) を製造する方法である。

## V' 法



- 15 第V' 1工程は、化合物 (302) を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物 (135) と化合物 (295) を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A 4工程と同様に行われる。

- 第V' 2工程は、化合物 (303) を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第  
 20 A 6工程と同様に行われる。

第V' 3工程は、化合物 (303) の $R^2$ が $\text{G}^2-\text{COOR}^7$ である場合、化合物

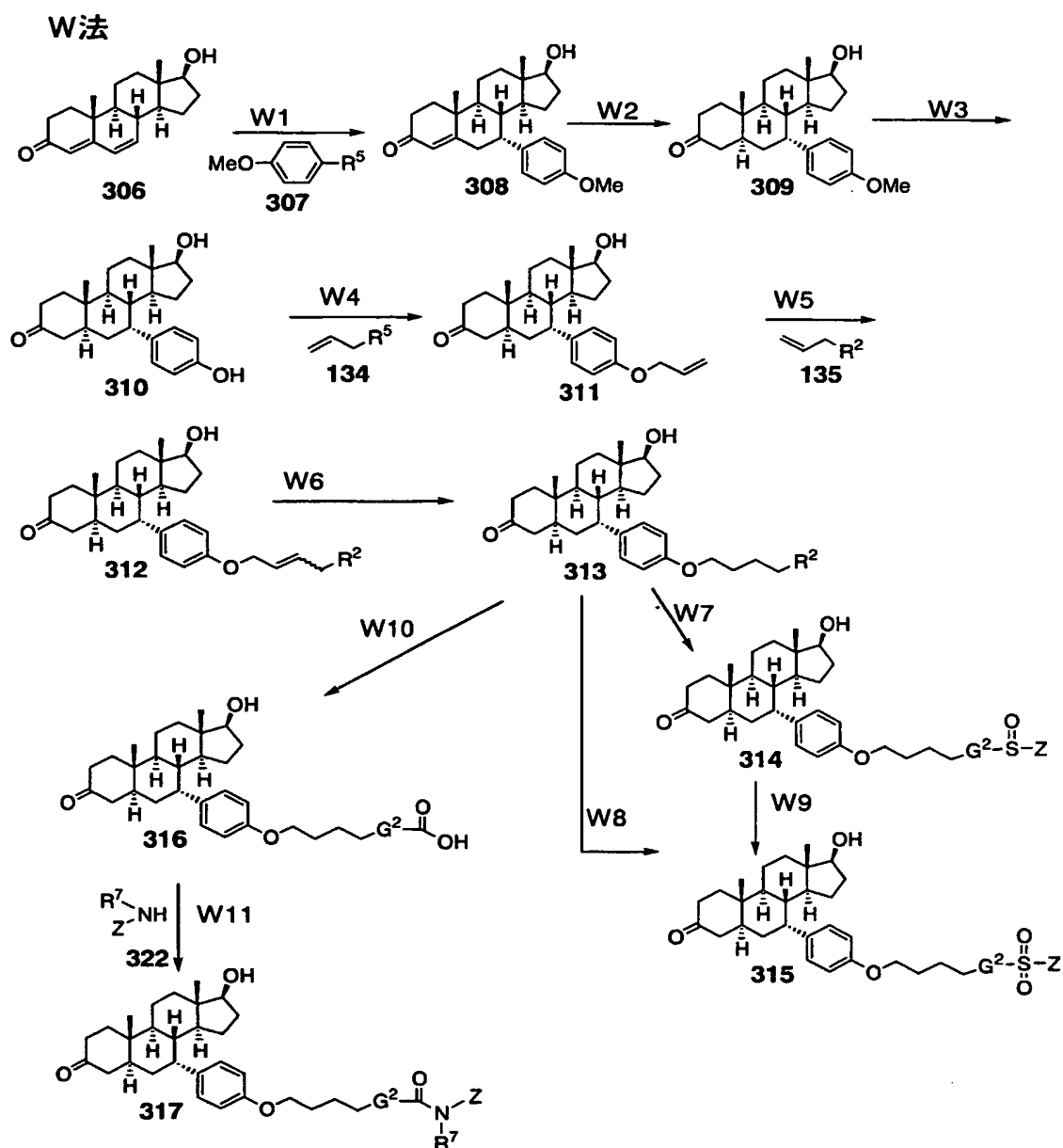
(304)を製造する工程で、水又は水溶性溶媒中、塩基又は酸(好適には、塩基)の存在下、化合物(303)を加水分解することにより達成され、本反応は、前記O法第O6工程と同様に行われる。

第V'4工程は、化合物(305)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物  
5 (304)又はその反応性誘導体(酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類)と、化合物(322)又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C3工程と同様に行われる。

W法は、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表  
10 される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が-O-であり、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に二重結合である化合物(308)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表さ  
15 れる基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が-O-であり、 $R^1$ がメチル基であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合である化合物(309)、一般式(I)で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、  
20  $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が-O-であり、 $R^1$ がアリル基であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合である化合物(311)、一般式(I)で表され  
25 る化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式(II)で表される基であり、かつその一般式(II)で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基(好ましくはp-フェニレン基)であり、 $A$ が-O-であり、 $R^1$ が-C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>-CH=CH-CH<sub>2</sub>- $R^2$ であり、 $R^a$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が

- 実線と共に単結合である化合物 (3 1 2)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が水素原子であり、 $X^2$  が、 $\alpha$  配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは *p*-フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-R^2$  であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒にあって  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合である化合物 (3 1 3)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が水素原子であり、 $X^2$  が、 $\alpha$  配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは *p*-フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-G^2-SO-Z$  であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒にあって  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合である化合物 (3 1 4)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が水素原子であり、 $X^2$  が、 $\alpha$  配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは *p*-フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-G^2-SO_2-Z$  であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒にあって  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合である化合物 (3 1 5)、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が水素原子であり、 $X^2$  が、 $\alpha$  配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは *p*-フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-G^2-COOH$  であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合している 3 位の炭素原子と一緒にあって  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合である化合物 (3 1 6)、及び、一般式 (I) で表される化合物のうち、 $X^1$  が水素原子であり、 $X^2$  が、 $\alpha$  配置の、一般式 (I I) で表される基であり、かつその一般式 (I I) で表される基のうち、 $A_r$  が芳香族炭化水素基（好ましくは *p*-フェニレン基）であり、 $A$  が  $-O-$  であり、 $R^1$  が  $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-G^2-CON(R^7)Z$  であり、 $R^3$  が水素原子であり、 $R^b$  及び  $R^c$  は、それらが結合し

ている 3 位の炭素原子と一緒にあって  $-(C=O)-$  であり、破線が実線と共に単結合である化合物 (317) を製造する方法である。



5

第W1工程は、化合物 (308) を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物 (307) と金属 (好適には、マグネシウム) 又はアルキルリチウム (好適には、*t*-ブチルリチウム) を反応させることにより得られる化合物 (307) の反応性誘導体を、不活性溶媒中、添加剤 (好適には、テトラキス [ヨウ化 (トリ-*n*



ーブチルホスフィン)銅(I)]の存在下、化合物(306)と反応させることにより達成され、本反応は、前記O法第O1工程と同様に行なわれる。

第W2工程は、化合物(309)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(308)を還元剤と反応させることにより達成され、本工程は、前記U'法第U'6工程と同様に行なわれる。

第W3工程は、化合物(310)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(309)を脱保護剤と反応させることにより達成され、本工程は、前記U法第U7工程と同様に行なわれる。

第W4工程は、化合物(311)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(310)に塩基を反応させることにより得られる化合物(310)の塩を、不活性溶媒中、化合物(134)と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A3工程と同様に行われる。

第W5工程は、化合物(312)を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物(135)と化合物(311)を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A4工程と同様に行われる。

第W6工程は、化合物(313)を製造する工程で、アルコール系溶媒もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A6工程と同様に行われる。

第W7工程は、化合物(313)の $R^2$ が $G^2-S-Z$ である場合、化合物(314)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(313)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる。

第W8工程は、化合物(313)の $R^2$ が $G^2-S-Z$ である場合、化合物(315)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(313)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A9工程と同様に行われる。

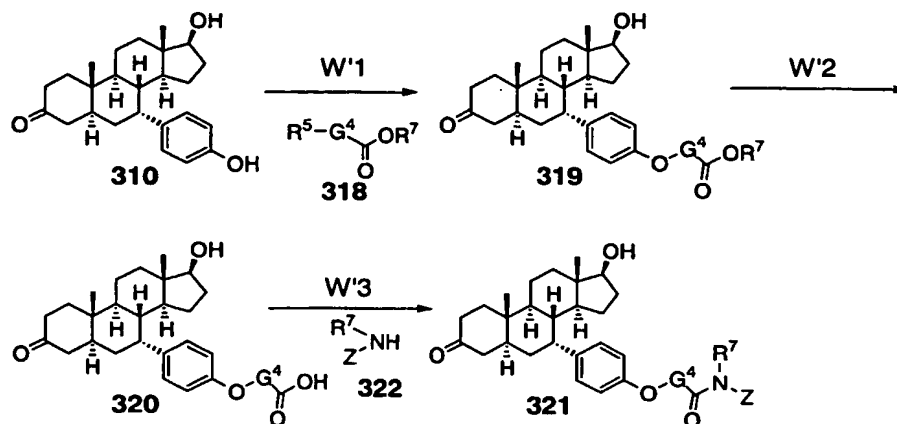
第W10工程は、化合物(313)の $R^2$ が $G^2-COOR^1$ である場合、化合物(316)を製造する工程で、水又は水溶性溶媒中、塩基又は酸(好適には、塩基)の存在下、化合物(313)を加水分解することにより達成され、本反応は、前記O法第O6工程と同様に行われる。

第W11工程は、化合物(317)を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物

(316) 又はその反応性誘導体（酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類）と、化合物（322）又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C3工程と同様に行われる。

- W' 法は、一般式（I）で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式（II）で表される基であり、かつその一般式（II）で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基（好ましくはp-フェニレン基）であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-G^4-COOR^7$ であり、 $R^8$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物（319）、一般式（I）で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式（II）で表される基であり、かつその一般式（II）で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基（好ましくはp-フェニレン基）であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-G^4-COOH$ であり、 $R^8$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物（320）、及び、一般式（I）で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式（II）で表される基であり、かつその一般式（II）で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基（好ましくはp-フェニレン基）であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-G^4-CON(R^7)Z$ であり、 $R^8$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合である化合物（321）を製造する工程である。

## W' 法



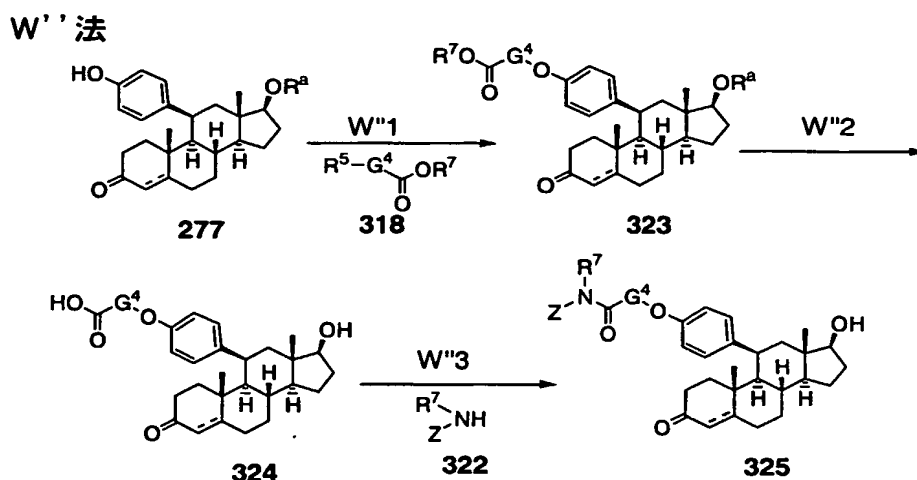
第W' 1工程は、化合物（319）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（310）に塩基を反応させることにより得られる化合物（310）の塩を、不活性溶媒中、化合物（318）と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A3工程と同様に行われる。

第W' 2工程は、化合物（320）を製造する工程で、水又は水溶性溶媒中、塩基又は酸（好適には、塩基）の存在下、化合物（319）を加水分解することにより達成され、本反応は、前記O法第O6工程と同様に行われる。

第W' 3工程は、化合物（321）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（320）又はその反応性誘導体（酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類）と、化合物（322）又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記C法第C3工程と同様に行われる。

W' 法は、一般式（I）で表される化合物のうち、 $X^2$ が水素原子であり、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式（II）で表される基であり、かつその一般式（II）で表される基のうち、 $Ar$ が芳香族炭化水素基（好ましくはp-フェニレン基）であり、 $A$ が $-O-$ であり、 $R^1$ が $-G^4-COOR^7$ であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって $-(C=O)-$ であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物（323）、一般式（I）で表される化合物のうち、 $X^2$ が水素原子であり、 $X^1$ が、 $\beta$ 配置の、一般式（II）で表される基であり、かつその一般式（II）で表される基のうち、 $Ar$ が芳香族炭化水

- 素基（好ましくはp-フェニレン基）であり、Aが-O-であり、R<sup>1</sup>が-G<sup>4</sup>-COOR<sup>7</sup>であり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物（324）、及び、一般式（I）で表される化合物のうち、X<sup>2</sup>が水素原子であり、X<sup>1</sup>が、β配置の、一般式（I I）で表される基であり、かつその一般式（I I）で表される基のうち、Arが芳香族炭化水素基（好ましくはp-フェニレン基）であり、Aが-O-であり、R<sup>1</sup>が-G<sup>4</sup>-CON(R<sup>7</sup>)Zであり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒にあって-(C=O)-であり、破線が実線と共に単結合又は二重結合である化合物（325）を製造する工程である。



- 第W' ' 1工程は、化合物（323）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（277）に塩基を反応させることにより得られる化合物（277）の塩を、不活性溶媒中、化合物（318）と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A3工程と同様に行われる。

- 第W' ' 2工程は、化合物（324）を製造する工程で、水系溶媒中、化合物（323）を酸と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A5工程と同様に行われる。

第W' ' 3工程は、化合物（325）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合

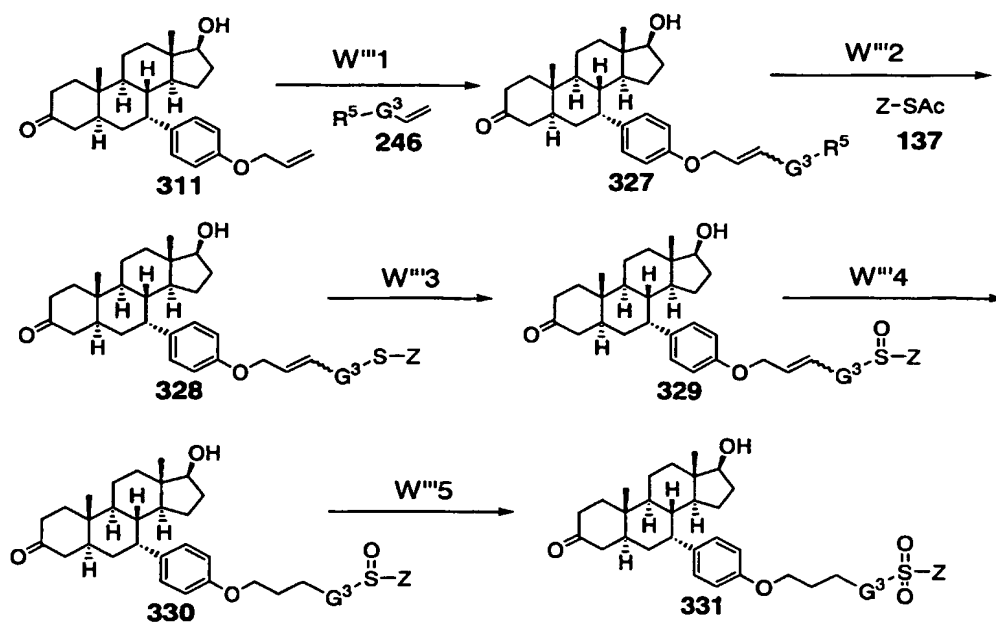
物（３２４）又はその反応性誘導体（酸ハライド類、混合酸無水物又は活性エステル類）と、化合物（３２２）又はその酸付加塩を反応させることにより達成され、本反応は、前記Ｃ法第Ｃ３工程と同様に行われる。

- W' ' ' 法は、一般式（Ｉ）で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、  
 5  $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式（ＩＩ）で表される基であり、かつその一般式（ＩＩ）で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基（好ましくはｐ－フェニレン基）であり、 $A$ が－Ｏ－であり、 $R^1$ が－ $CH_2-CH=CH-G^3-R^5$ であり、 $R^5$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している３位の炭素原子と一緒にあって－（ $C=O$ ）－であり、破線が実線と共に単結合である化合物（３２７）、  
 10 一般式（Ｉ）で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式（ＩＩ）で表される基であり、かつその一般式（ＩＩ）で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基（好ましくはｐ－フェニレン基）であり、 $A$ が－Ｏ－であり、 $R^1$ が－ $CH_2-CH=CH-G^3-S-Z$ であり、 $R^5$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している３位の炭素原子と一緒にあって－（ $C=O$ ）－であり、破線が実線と共に単結合である化合物（３２８）、一般式（Ｉ）  
 15 で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式（ＩＩ）で表される基であり、かつその一般式（ＩＩ）で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基（好ましくはｐ－フェニレン基）であり、 $A$ が－Ｏ－であり、 $R^1$ が－ $CH_2-CH=CH-G^3-SO-Z$ であり、 $R^5$ が水素原子であり、 $R^b$   
 20 及び $R^c$ は、それらが結合している３位の炭素原子と一緒にあって－（ $C=O$ ）－であり、破線が実線と共に単結合である化合物（３２９）、一般式（Ｉ）で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式（ＩＩ）で表される基であり、かつその一般式（ＩＩ）で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭化水素基（好ましくはｐ－フェニレン基）であり、 $A$ が－Ｏ－であり、 $R^1$ が－  
 25  $CH_2-CH_2-CH_2-G^3-SO-Z$ であり、 $R^5$ が水素原子であり、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している３位の炭素原子と一緒にあって－（ $C=O$ ）－であり、破線が実線と共に単結合である化合物（３３０）、及び、一般式（Ｉ）で表される化合物のうち、 $X^1$ が水素原子であり、 $X^2$ が、 $\alpha$ 配置の、一般式（ＩＩ）で表される基であり、かつその一般式（ＩＩ）で表される基のうち、 $A_r$ が芳香族炭

化水素基（好ましくはp-フェニレン基）であり、Aが-O-であり、R<sup>1</sup>が-C H<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-G<sup>3</sup>-SO<sub>2</sub>-Zであり、R<sup>a</sup>が水素原子であり、R<sup>b</sup>及びR<sup>c</sup>は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に-C(=O)-であり、破線が実線と共に単結合である化合物（331）を製造する工程である。

5

### W'''法



第W'''1工程は、化合物（327）を製造する工程で、不活性溶媒中、有機金属触媒存在下、化合物（246）と化合物（311）を反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A4工程と同様に行われる。

第W'''2工程は、化合物（328）を製造する工程で、アルコール系溶媒中、化合物（137）と金属アルコキシドを反応させることにより得られる化合物（137）の反応性誘導体を、アルコール系溶媒中、化合物（327）と反応させることにより達成され、本反応は、前記B法第B4工程と同様に行われる。

第W'''3工程は、化合物（329）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（328）を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記A法第A8工程と同様に行われる。

第W'''4工程は、化合物（330）を製造する工程で、アルコール系溶媒

もしくは不活性溶媒中、接触還元を行うことにより達成され、本反応は、前記A法第A 6工程と同様に行われる。

第W' ' ' 5工程は、化合物(3 3 1)を製造する別の工程で、不活性溶媒中、化合物(3 3 0)を酸化剤と反応させることにより達成され、本反応は、前記  
5 A法第A 9工程と同様に行われる。

W' ' ' 法において、化合物(3 2 7)より、第W' ' ' 4工程→第W' ' ' 2工程→第W' ' ' 3工程の順に反応を行なっても、化合物(3 3 0)を得ることができる。また、化合物(3 2 7)より、第W' ' ' 4工程→第W' ' ' 2工程→第W' ' ' 5工程の順に反応を行なっても、化合物(3 3 1)を得ることができる。また、化合物(3 2 9)より、第W' ' ' 5工程→第W' ' ' 4工程の  
10 順に反応を行なっても、化合物(3 3 1)を得ることができる。

前記A法～W法、B' 法～L' 法、S' 法～W' 法、U' ' 法、W' ' 法及びW' ' ' 法において、G及び／又はJ及び／又はQ<sup>2</sup>が、炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基で保護されているカルボキシ基を含む基である場合、公知の方法で加水分解を行なうことにより、容易に脱保護され、カルボキシ  
15 基を含む基に変換することができる。

前記A法～W法、B' 法～L' 法、S' 法～W' 法、U' ' 法、W' ' 法及びW' ' ' 法の各工程において、保護及び脱保護の必要な基が存在する場合は、各々の基について、当業者に周知の方法で、保護及び脱保護を行うことができる。  
20 保護及び脱保護にあたっては、例えば、"Protective Groups in Organic Synthesis 2nd edition", Theodora W. Green, John Wiley & Sons, Inc., 1991等を参照することができる。

原料である化合物(1)は、公知か、公知の方法又はそれに類似した方法にしたがって、容易に製造される。[例えば、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー、第3 5巻、第1 1号、第2 1 1 3頁～第2 1 2 9頁、1 9 9 2年：J. Med. Chem. 35(11)、2113-2129(1992)、シンセティック・コミュニケーションズ、第2 4巻、第1 6号、第2 3 2 5頁～第2 3 4 0頁、1 9 9 4年：Synth. Commun. 24(16)、2325-2340(1994)、ステロイズ、第6 0巻、第5号、第4 1 4頁～第4 2 2頁、1 9 9 5年：Steroids, 60(5)、414-422(1995)等]。

原料である化合物（１０８）は、公知か、公知の方法又はそれに類似した方法にしたがって、容易に製造される。〔例えば、テトラヘドロン・レターズ、第２９巻、第１３号、第１５３３頁～第１５３６頁、１９８８年：Tetrahedron Letters、29(13)、1533-1536(1988)等。〕

- ５ 原料である化合物（９６）は、市販品として容易に入手することができるか、又は、公知の方法又はそれに類似した方法にしたがって、容易に製造される。〔例えば、J. Chem. Res. Miniprint, 2, 0650～0669(1986)等。〕

原料である化合物（１１９）及び化合物（１４４）は、市販品として容易に入手することができる。

- １０ 原料である化合物（１３３）～化合物（１４３）、化合物（１８３）、化合物（２０４）、化合物（２１８）～化合物（２２０）、化合物（２２４）、化合物（２３６）、及び化合物（２５７）は、市販品として容易に入手することができるか、あるいは、公知か、公知の方法又はそれに類似した方法にしたがって、容易に製造される。

- １５ 原料である化合物（１４８）及び（１６４）は、公知か、公知の方法又はそれに類似した方法にしたがって、容易に製造される。〔例えば、ステロイズ、第５９巻、第１９０頁～第１９５頁、１９９４年：Steroids、59、190-195(1994)等。〕

- ２０ 原料である化合物（２２３）は、公知か、公知の方法又はそれに類似した方法にしたがって、容易に製造される。〔例えば、シンセティック・コミュニケーションズ、第２７巻、第２３号、第４０３５頁～第４０４０頁、１９９７年：Synth. Commun. 27(23)、4035-4040(1997)等。〕

- ２５ 本発明の、一般式（Ｉ）で表される化合物、及び、アンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、アゴニストとして作用しない物質（以下、被験物質とも称する。）の抗アンドロゲン活性を始めとする効果は、本発明の、アンタゴニストとして作用することの定義及び／又はアゴニストとして作用しないことの定義に用いたアンドロゲンレセプターレポータージーンアッセイ法と、以下のＡ測定法～Ｆ測定法の測定法とを、必要に応じて適宜組み合わせることによって測定できる：



A測定法：ラットでのin vivo実験による測定法A-1測定法：アンタゴニスト作用の測定法

- 去勢ラットにテストステロンやジヒドロテストステロンを投与すると前立腺、及び精嚢腺重量が増加する。テストステロンやジヒドロテストステロンによる前立腺、及び精嚢腺の重量増加作用を被験物質が抑制するか否かを検討することにより、被験物質のアンタゴニスト作用を調べることができる。測定にあたっては、J. Med. Chem., 41:623-639, 1998や基礎と臨床、29(4):877-885, 1995等を参考にできる。

A-2測定法：アゴニスト作用の測定法

- 去勢ラットに被験物質を連続投与する。投与後にアンドロゲン応答性の臓器である前立腺、精嚢腺重量が増加するか否かを検討することにより、被験物質のアゴニスト作用を検討できる。測定にあたっては、日内分泌会誌、66:597-606, 1990等を参考にできる。

B測定法：アンドロゲン受容体の二量体形成による測定法

- 15 B-1測定法：二量体形成の阻害作用による測定法

- ジヒドロテストステロンによりアンドロゲン受容体の二量体が形成される。アンドロゲン受容体の二量体形成を被験物質が阻害するか否かをゲルシフトアッセイで測定することにより、被験物質のアンタゴニスト作用を検討できる。測定にあたっては、J. Biol. Chem., 268:19004-19012, 1993、J. Biol. Chem., 270:19998-20003, 1995等を参考にできる。

B-2測定法：アンドロゲン受容体の二量体形成の促進作用による測定法

- 被験物質がアンドロゲン受容体の二量体形成を促進するか否かをゲルシフトアッセイで測定することにより被験物質のアゴニスト作用を検討できる。測定にあたっては、J. Biol. Chem., 268:19004-19012, 1993、J. Biol. Chem., 270:19998-20003, 1995等を参考にできる。

C測定法：オルニチンデカルボキシラーゼ (Ornithine Decarboxylase: ODC) 活性による測定法

被験物質が、アンドロゲン依存性活性を示すとされているODC活性を上昇させるのか減少させるのかを測定することにより、被験物質のアゴニスト、アンタゴニ

スト作用を検討できる。測定にあたっては、Anal. Biochem., 113:352-355, 1981、日内分泌会誌、66:597-606, 1990等を参考にできる。

D測定法：アンドロゲン受容体に対する結合能による測定法

- 5     アンドロゲン受容体とアンドロゲンとの結合を被験物質が阻害するのか否かを、バインディングアッセイ (Binding Assay) で検討することにより、被験物質のアンタゴニスト作用を検討できる。測定にあたっては、Urology, 48:157-163, 1996、J. Biol. Chem., 270:19998-20003, 1995、基礎と臨床、29(4): 877-885, 1995等を参考にできる。

E測定法：アンドロゲン受容体量の増減による測定法

- 10    アンドロゲン受容体発現細胞に、アンドロゲン存在下及び非存在下で被験物質を処理した場合の細胞内アンドロゲン受容体量の増減を調べることにより、被験物質のアンドロゲン受容体に対するアゴニスト作用、及びアンタゴニスト作用を検討できる。測定にあたっては、Endocrinology, 129:2000-2010, 1991等を参考にできる。

15    F測定法：アンドロゲン受容体の核内移行による測定法

- アンドロゲン受容体発現細胞に対して、アンドロゲンの存在下又は非存在下において、被験物質を処理する事により、細胞内のアンドロゲン受容体の局在を免疫組織染色により調べることで、アンドロゲン受容体の核内移行性の有無や、被験物質によるアンドロゲン受容体の核内移行に対する阻害作用を調べることができ、被験物質のアゴニスト、及び／又はアンタゴニストとしての作用を検討できる。測定にあたっては、J. Biol. Chem., 267:968-974, 1992等を参考にできる。

- 25    本発明の一般式 (I) で表される化合物、及び本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質は、長期投与によるアンドロゲン抵抗性の発現、及び／又は肝毒性などの副作用を示さない抗アンドロゲン剤となることが期待され、医薬組成物、例えば、前立腺癌、前立腺肥大症、男性型脱毛症、性的早熟、尋常性座瘡、脂漏症、及び多毛症等の疾患の治療剤として有用となることが期待される。また、本発明の一般式 (I

）で表される化合物、及び本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質を、予め投与しておけば、前立腺癌、前立腺肥大症、男性型脱毛症、性的早熟、尋常性座瘡、脂漏症、及び多毛症等の疾患の発症を防ぐか遅延させることが期待できるので、これらの疾患の予防剤となることも期待できる。

本発明の一般式（I）で表される化合物を有効成分とする医薬組成物、及び本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質を有効成分とする医薬組成物は、経口的に又は非経口的に投与することができるが、経口的に投与するのが望ましい。投与に関しては投与方法に適した製剤に調製することができる。

本発明の一般式（I）で表される化合物を有効成分とする医薬組成物、及び本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質を有効成分とする医薬組成物は、通常の製剤化技術を用いて製剤化することができ、その用途に応じて錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤、シロップ剤、注射剤、軟膏剤などの固体及び液体の製剤として使用することができる。製剤用の担体や賦形剤としては、固体又は液体状の物質が挙げられる。これらの例としては、乳糖、ステアリン酸マグネシウム、スターチ、タルク、ゼラチン、寒天、ペクチン、アラビアゴム、オリーブ油、ごま油、エチレングリコール等やその他、常用のものが例示される。

かかる製剤中の、本発明の一般式（I）で表される化合物を有効成分とする医薬組成物、及び本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質の含有量は、その剤型によって異なるが、一般に5～100重量%の濃度で含有していることが望ましい。本発明の一般式（I）で表される化合物を有効成分とする医薬組成物、及び本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質の医薬組成物は、対象とする人間をはじめとする温血動物の種類、症状の軽重、医師の診断などに応じて、広範囲に変えることができるが、一般に有効成分として、1日あたり $1\mu\text{g}$ ～ $500\text{mg}/\text{kg}$ 、好ましくは1日あたり $20\mu\text{g}$ ～ $100\text{mg}/\text{kg}$ である。また、上記投与量は1日～1ヶ月当たり1回又は数回に、

まとめて又は分けて投与することができ、症状の軽重、医師の判断により適宜変更することができる。

### 実施例

#### 実施例 1：フルタミド、ピカルタミドのアゴニスト作用の検討

- 5      トランスフェクションの24時間前に、 $1.0 \times 10^5$ 個のHeLa細胞を12ウエルのマイクロプレート中でphenol red free DMEM/5%DCC-FBSで培養する。500 ng/wellのMMTV-Lucベクターと100 ng/wellのpSG5-hAR、5 ng/wellのRenilla Luc vectorをHeLa細胞にトランスフェクションする。トランスフェクションはphenol red free DMEM培養液中で3 mL/wellのリポフェクトアミンを用いて行う。トランスフェクション
- 10    の9時間後に培養液を、それぞれ10 mmol/Lのハイドロキシフルタミド又はピカルタミドを含むphenol red free DMEM/3%DCC-FBSに交換する。培養液交換の48時間後に転写活性値を測定する。転写活性はDual-Luciferase Reporter Assay Systemで測定する。(転写活性値) = (ホタルルシフェラーゼの値) / (ウミシイタケルシフェラーゼの値) とする。ハイドロキシフルタミド及びピカルタミド
- 15    は無添加値の5倍以上の値を示し、ハイドロキシフルタミド及びピカルタミドのアゴニスト作用が確認された(表1)。

### <表 1>

20	ルシフェラーゼ活性 (Fold induction) <sup>1)</sup>	
	無添加	1.00
	10 $\mu$ mol/Lハイドロキシフルタミド	7.84 (>5.0)
	10 $\mu$ mol/Lピカルタミド	7.62 (>5.0)

- 25      1) 無添加のルシフェラーゼ活性値を1.00にした時の値

#### 実施例 2：フルタミド、ピカルタミドのアンタゴニスト作用の検討

トランスフェクションの24時間前に、 $1.0 \times 10^5$ 個のHeLa細胞を12ウエルのマイクロプレート中でphenol red free DMEM/5%DCC-FBSで培養する。500 ng/wellのMMTV

- Lucベクターと100 ng/wellのpSG5-hAR、5 ng/wellのRenilla Luc vectorをHeLa細胞にトランスフェクションする。トランスフェクションはphenol red free DMEM培養液中で3 mL/wellのリポフェクトアミンを用いて行う。トランスフェクションの9時間後に培養液を、0.1 nmol/LのDHT、1.0 mmol/Lのハイドロキシフルタミド又はピカルタミドを含むphenol red free DMEM/3%DCC-FBSに交換する。培養液交換の48時間後に転写活性値を測定する。転写活性はDual-Luciferase Reporter Assay Systemを用いて行う。(転写活性値) = (ホタルルシフェラーゼの値) / (ウミシイタケルシフェラーゼの値) と定義する。ハイドロキシフルタミド及びピカルタミドは DHTの転写活性値を50%以下に減少させ、ハイドロキシフルタミド及びピカルタミドのアンタゴニスト作用が確認された(表2)。

<表2>

ルシフェラーゼ活性 (Relative activity) <sup>2)</sup>	
0.1 nmol/L DHT	100
1.0 $\mu$ mol/Lハイドロキシフルタミド	29.0 (<50.0)
1.0 $\mu$ mol/Lピカルタミド	32.0 (<50.0)

2) 0.1 nmol/LのDHTのルシフェラーゼ活性値を100にした時の値

### 実施例3

17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -(7-カルボキシヘプチル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オンの合成

(第1工程)

17 $\beta$ -t-ブチルジメチルシリルオキシ-7 $\alpha$ -(2-プロペン-1-イル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン

-78℃にて液体アンモニア(150ml)に金属リチウム(220mg)を加えた。5分間攪拌した後、17 $\beta$ -t-ブチルジメチルシリルオキシ-7 $\alpha$ -

(2-プロペン-1-イル)-4-アンドロステン-3-オン (1.261 g) 及びt-ブタノール (0.41 ml) のテトラヒドロフラン溶液 (20 ml) を加え、20分間攪拌した。1,2-ジブロモエタン (3 ml) 及び塩化アンモニウム (30 g) を加え、25℃にて30分間攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10) で精製して目的物810.7 mg (収率64%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.01 (6H, s), 0.73 (3H, s), 0.88 (9H, s), 1.04 (3H, s), 0.92-2.45 (23H, m), 3.55 (1H, t, J=8.3 Hz), 4.93 (1H, d, J=3.8 Hz), 4.99 (1H, s), 5.58-5.72 (1H, m)。

Rf値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル:ヘキサン=1:4) : 0.54。

15 (第2工程)

17β-t-ブチルジメチルシリルオキシ-7α-(7-メトキシカルボニル-2-ヘプテン-1-イル)-5α-アンドロスタン-3-オン

17β-t-ブチルジメチルシリルオキシ-7α-(2-プロペン-1-イル)-5α-アンドロスタン-3-オン (596.1 mg) をジクロロメタン (5 ml) に溶解し、メチル 6-ヘプテノエート (384.4 mg) 及びベンジリデンビス (トリシクロヘキシルホスフィン) -ジクロロルテニウム (57.0 mg) を加え、アルゴン雰囲気下、5時間加熱還流した。放冷後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10) で精製して目的物527.6 mg (収率70%) を得た。

25 <sup>1</sup>H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.01 (6H, s), 0.71 (3H, s), 0.88 (9H, s), 1.03 (3H, s), 0.90-2.10 (26H, m), 2.18-2.43 (5H, m), 3.51 (1H, t, J=8.4 Hz), 3.67 (3H, s), 5.18-5.40 (2H, m)。

R<sub>f</sub> 値（シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：4）：0.43。

（第3工程）

17β-ヒドロキシ-7α-(7-カルボキシヘプチル)-5α-アンドロス

5 タン-3-オン

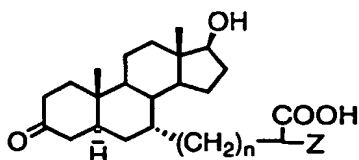
17β-t-ブチルジメチルシリルオキシ-7α-(7-メトキシカルボニル-2-ヘプテン-1-イル)-5α-アンドロスタン-3-オン（505.5mg）を酢酸エチル（30ml）に溶解し、10%-パラジウム／炭素（148mg）を加え、水素雰囲気下、25℃にて4時間攪拌した。反応液を濾過、減圧下にて溶媒を留去して得られた残さをアセトン（10ml）に溶解し、1N-HCl（1ml）を加え、26時間加熱還流した。放冷後、水を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：2～1：1）で精製して目的物362.6mg（  
15 収率93%）を得た。

<sup>1</sup>H-NMR（270MHz、CDCl<sub>3</sub>）δ：0.76（3H、s）、1.04（3H、s）、1.00-1.82（27H、m）、1.98-2.15（3H、m）、2.23-2.48（5H、m）、3.65（1H、t、J=8.7Hz）。

20 Mass（FAB）：433（M+1）。

R<sub>f</sub> 値（シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：1）：0.27。

実施例3と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	Z	分子量	Mass
4	4	H	404	405 (FAB)
5	8	H	460	461 (FAB)
6	10	H	488	489 (FAB)

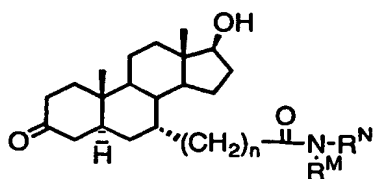
7	1 2	H	5 1 6	5 1 7 (FAB)
8	8	— (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6 2 0	6 2 1 (ESI)

## [実施例 9]

17β-ヒドロキシ-7α-{7-(N,N-ジメチルアミノカルボニル)ヘプチル}-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

- 5 実施例 3 で得られた 17β-ヒドロキシ-7α-(7-カルボキシヘプチル)-5α-アンドロスタン-3-オン (9.9mg) をテトラヒドロフラン (0.5ml) に溶解し、1-(N,N-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 (13.0mg)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール-水合物 (10.5mg) 及び 2.0M-ジメチルアミン テトラヒドロフラン溶液 (68.7μl) を加え、25℃にて 15 時間攪拌した。酢酸エチル (2.0ml) を加え、1N-塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水にて洗浄した。硫酸マグネシウムにて乾燥し、NHシリカゲル (富士シリシア化学株式会社製、Pro. No. DM1020) にて濾過し、減圧下溶媒を留去し、目的物 10.5mg (99.7%) を得た。
- 15 1H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.76 (3H, s)、1.04 (3H, s)、1.00-1.83 (27H, m)、1.95-2.16 (3H, m)、2.23-2.47 (5H, m)、2.94 (3H, s)、3.01 (3H, s)、3.65 (1H, t, J=8.7Hz)。  
Mass (ESI): 460 (M+1)。
- 20 Rf 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; メタノール: クロロホルム=1:10): 0.28。

実施例 9 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。

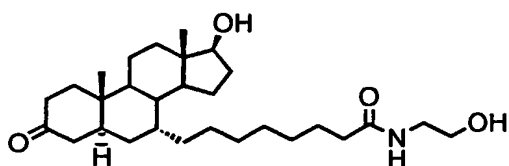




実施例	n	R <sup>M</sup>	R <sup>N</sup>	分子量	Mass
10	7	H	Et	459	460 (FAB)
11	7	H	cyclohexylmethyl	527	528 (FAB)
12	7	H	cyclopropylmethyl	485	486 (FAB)
13	7	H	n-Bu	487	488 (ESI)
14	7	H	i-Pr	473	474 (FAB)
15	7	H	t-Bu	487	488 (FAB)
16	7	H	c-hexyl	513	514 (ESI)
17	7	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OH	489	490 (ESI)
18	7	Me	n-Bu	501	502 (ESI)
19	7	Et	Et	487	488 (ESI)
20	7		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	499	500 (ESI)
21	7	H	4-t-butylbenzyl	577	578 (ESI)
22	7	H	-CH <sub>2</sub> CHPh <sub>2</sub>	611	612 (ESI)
23	7	H	2-furylmethyl	511	512 (ESI)
24	7	H	Me	445	446 (ESI)
25	7	Me	Et	473	474 (ESI)
26	7	Me	n-Pr	487	488 (ESI)
27	7	Me	i-Pr	487	488 (FAB)
28	7	Me	Bn	535	536 (ESI)
29	7		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	485	486 (ESI)
30	7		-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	501	502 (ESI)
31	7	Me	t-Bu	501	502 (ESI)
32	7	H	cyclopropyl	471	472 (ESI)
33	6	Me	Me	445	446 (FAB)
34	6	Et	Et	473	474 (FAB)
35	6		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	485	486 (FAB)
36	8	Me	Me	473	474 (ESI)
37	8	Et	Et	501	524 (ESI)
38	8	Me	n-Bu	515	538 (ESI)
39	8	H	Bn	535	558 (ESI)
40	8	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH	489	512 (ESI)
41	8		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	513	514 (ESI)
42	9	Me	Me	487	488 (ESI)
43	9	Et	Et	515	516 (ESI)
44	9		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	513	514 (ESI)

45	9	Me	Et	501	502 (ESI)
46	9	Me	n-Bu	529	530 (ESI)
47	9	H	Bn	549	550 (ESI)
48	9	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		527	528 (ESI)
49	9	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH	503	504 (ESI)
50	9	Me	n-Pr	515	516 (ESI)
51	9	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		529	530 (ESI)
52	10	Me	Me	501	502 (FAB)
53	10	Et	Et	529	530 (FAB)
54	10	Me	Et	515	516 (FAB)
55	10	Me	n-Pr	529	530 (FAB)
56	10	Me	n-Bu	543	544 (FAB)
57	10	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		543	544 (FAB)
58	11	Me	Me	515	516 (FAB)
59	11	Et	Et	543	544 (FAB)
60	11	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		555	556 (FAB)
61	11	H	Bn	577	578 (FAB)
62	11	Me	n-Bu	557	558 (FAB)
63	11	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH	531	532 (FAB)

## [実施例64]



5 17β-ヒドロキシ-7α-[7-{N-(2-ヒドロキシエチル)アミノカルボニル}ヘプチル]-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

実施例3で得られた17β-ヒドロキシ-7α-(7-カルボキシヘプチル)-5α-アンドロスタン-3-オン(10.3mg)及びO-(7-アザベンゾトリアゾール-1-イル)-1,1,3,3-テトラメチルウロミウムヘキサフルオロホスフェート(30mg)をテトラヒドロフラン(1ml)に溶解し、N, N-ジイソプロピルエチルアミン(25μl)及び2-アミノエタノール(4.4μl)を加え、25℃にて2時間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加え、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、1N-塩酸及び飽和食塩水にて洗浄した。有機層にNHシリカゲル(富士シリシア化学株式会社製、Pro. No. DM1020

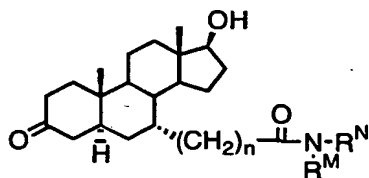
）を加えて5分間攪拌し、濾過し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、メタノール：クロロホルム＝1：10）で精製して目的物7.5mg（収率66%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (270MHz、 $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.76 (3H, s)、1.04 (3H, s)、0.95–1.82 (28H, m)、1.95–2.10 (3H, m)、2.20 (2H, t,  $J=7.4\text{Hz}$ )、2.28–2.45 (2H, m)、3.43 (2H, q,  $J=5.2\text{Hz}$ )、3.60–3.78 (3H, m)、5.98 (1H, brs)。

Mass (ESI): 476 (M+1)。

10 Rf値（シリカゲルプレート、展開溶媒；メタノール：クロロホルム＝1：10）：0.12。

実施例64と同様な方法により、以下の化合物を合成した。

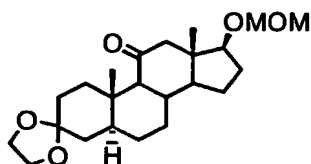


実施例	n	R <sup>M</sup>	R <sup>N</sup>	分子量	Mass
65	7	H	n-Pr	473	474 (FAB)
66	7	H	n-hexyl	515	516 (ESI)
67	7	H	i-pentyl	501	502 (FAB)
68	7	H	i-Bu	487	488 (FAB)
69	7	H	neopentyl	501	502 (ESI)
70	7	H	3-pentyl	501	502 (ESI)
71	7	n-hexyl	n-hexyl	599	600 (ESI)
72	7	H	Ph	507	508 (ESI)
73	7	H	Bn	521	522 (ESI)
74	7	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	535	536 (ESI)

## [実施例 7 5]

17β-ヒドロキシ-11β-(9-カルボキシノニル)-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

## 5 (第1工程)

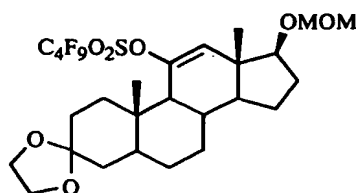
3,3-エチレンジオキシ-17β-(メトキシメトキシ)-5α-アンドロスタン-11-オン

3,3-エチレンジオキシ-17β-ヒドロキシ-5α-アンドロスタン-11-オン (1.84 g) をジクロロメタン (30 ml) に溶解し、0℃にてN,N-ジイソプロピルエチルアミン (2.7 ml) 及びクロロメチルメチルエーテル (1.2 ml) を滴下したのち、25℃にて8時間攪拌した。反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液中に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:1) で精製して目的物1.98 g (収率95%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.72 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.03-1.38 (7H, m), 1.52-1.80 (9H, m), 2.05-2.23 (2H, m), 2.36-2.48 (2H, m), 3.33 (3H, s), 3.70 (1H, t, J=8.4 Hz), 3.92 (4H, s), 4.57 (1H, d, J=14.2 Hz), 4.60 (1H, d, J=14.2 Hz)。

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル:n-ヘキサン=1:1) : 0.61。

## (第2工程)



3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11- [{ (1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ノナフルオロブチル) スルホニル} オキシ] -5α-アンドロスト-11-エン

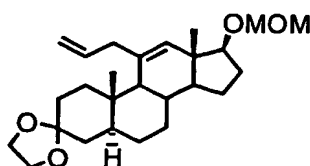
- 5 リチウムジイソプロピルアミド (ジイソプロピルアミン (0.15 ml) 及び n-ブチルリチウム (1.5 Mヘキサン溶液) (0.69 ml) から調整) のテトラヒドロフラン (1.3 ml) の溶液に-78℃で3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-5α-アンドロスタン-11-オン (100 mg) のテトラヒドロフラン (1.3 ml) 溶液を5分間で滴下した。-78℃で3
- 10 0分間攪拌した後、パーフルオロブタンスルホニルフルオリド (0.13 ml) を5分間で滴下した。-78℃で5分間攪拌した後、室温で2時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル : n-ヘキサ
- 15 ン=1 : 6) で精製して目的物98.8 mg (収率57%) を得た。

1H-NMR (270 MHz、CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.93 (3H、s)、0.96 (3H、s)、0.83-2.23 (18H、m)、3.34 (3H、s)、3.70 (1H、t、J=8.2 Hz)、3.93 (4H、s)、4.58 (1H、d、J=6.6 Hz)、4.63 (1H、d、J=6.6 Hz)、6.20 (1H、s)。

20

Rf 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒 ; 酢酸エチル : ヘキサン=1 : 2) : 0.67。

(第3工程)



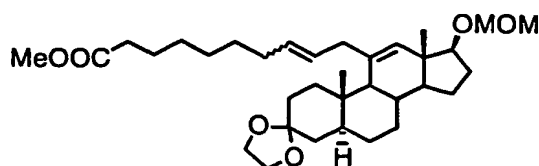
3, 3-エチレンジオキシ-17β-(メトキシメトキシ)-11-(2-プロペン-1-イル)-5α-アンドロスト-11-エン

3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11-[ {(1, 1  
5, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ノナフルオロブチル) スルホニル} オキシ] -  
5α-アンドロスト-11-エン (454. 5mg) をテトラヒドロフラン (6  
ml) に溶解し、アリルトリブチルスズ (299. 1mg)、塩化リチウム (9  
0. 0mg) 及びテトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (47. 7  
mg) を加え、アルゴン雰囲気下、22時間加熱還流した。放冷後、フッ化カリ  
10 ウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水及び飽和食塩水にて洗  
浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。得ら  
れた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル : n-  
ヘキサン = 1 : 9) で精製して目的物 275. 8mg (収率 98%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270MHz、CDCl<sub>3</sub>) δ : 0. 83 (3H、s)、0.  
15 89 (3H、s)、0. 93-1. 88 (16H、m)、1. 98-2. 12 (2H、m)、2. 72-2. 92 (2H、m)、3. 37 (3H、s)、3. 5  
9 (1H、t、J=8. 7Hz)、3. 94 (4H、s)、4. 62 (1H、d、J=10. 1Hz)、4. 65 (1H、d、J=10. 1Hz)、4. 91-  
5. 02 (2H、m)、5. 65-5. 82 (1H、m)、5. 88 (1H、s  
20 ) 。

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒 ; 酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 4)  
): 0. 53。

(第4工程)



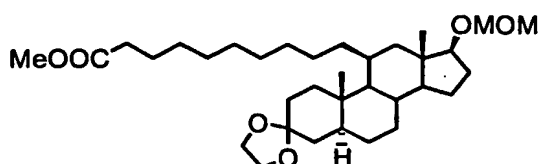
3, 3-エチレンジオキシ-17β-(メトキシメトキシ)-11-(9-メトキシカルボニル-2-ノネン-1-イル)-5α-アンドロスト-11-エン

3, 3-エチレンジオキシ-17β-(メトキシメトキシ)-11-(2-ブ  
 5 ロペン-1-イル)-5α-アンドロスト-11-エン (248.5mg) をジ  
 クロロメタン (3ml) に溶解し、メチル 8-ノネノエート (202.9mg)  
 及びベンジリデンビス (トリシクロヘキシルホスフィン) -ジクロロルテニウム  
 (27.3mg) を加え、アルゴン雰囲気下、5時間加熱還流した。放冷後、シ  
 リカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル : n-ヘキサン = 1  
 10 : 6) で精製して目的物 227.8mg (収率 68%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.83 (3H, s), 0.  
 88 (3H, s), 0.90-1.40 (13H, m), 1.40-1.83 (  
 11H, m), 1.90-2.12 (4H, m), 2.30 (2H, t, J=7  
 . 6Hz), 2.65-2.84 (2H, m), 3.36 (3H, s), 3.6  
 15 0 (1H, t, J=8.4Hz), 3.66 (3H, s), 3.93 (4H, s  
 ), 4.63 (1H, d, J=11.2Hz), 4.65 (1H, d, J=11  
 . 2Hz), 5.23-5.40 (2H, m), 5.87 (1H, s)。

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒 ; 酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 6  
 ) : 0.23。

20 (第5工程)



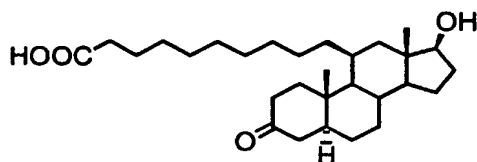
3, 3-エチレンジオキシ-17β-(メトキシメトキシ)-11β-(9-メトキシカルボニルノニル)-5α-アンドロスタン

3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -(メトキシメトキシ)-11-(9-メトキシカルボニル-2-ノネン-1-イル)-5 $\alpha$ -アンドロスト-11-エン (226.3 mg) を酢酸エチル (5 ml) に溶解し、イリジウム黒 (55.7 mg) を加え、水素雰囲気下、25 $^{\circ}$ Cにて5日間攪拌した。反応液をセライト濾過し、減圧下濃縮して得られた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10~1:6) で精製して目的物165.9 mg (収率73%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (270 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.85 (3H, s), 0.93 (3H, s), 0.95-1.05 (3H, m), 1.10-1.41 (20 OH, m), 1.45-1.80 (11H, m), 1.90-2.07 (2H, m), 2.16 (1H, d,  $J=12.5\text{ Hz}$ ), 2.30 (2H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 3.35 (3H, s), 3.43 (1H, t,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 3.66 (3H, s), 3.93 (4H, s), 4.62 (2H, s)。

Rf値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル:n-ヘキサン=1:4) : 0.47。

(第6工程) 32-54



17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -(9-カルボキシノニル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン

3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -(メトキシメトキシ)-11 $\beta$ -(9-メトキシカルボニルノニル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン (91.0 mg) をアセトン (3 ml) に溶解し、1N-塩酸 (0.5 ml) を加え、24時間加熱還流した。放冷後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル:クロロホルム=1:6~1:2) で精製して目的物70.0 mg (収率94%) を得た

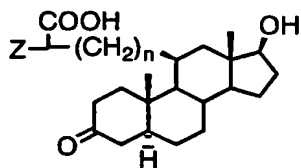


1H-NMR (270MHz、CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.85 (3H、s)、0.90-1.03 (4H、m)、1.15 (3H、s)、1.16-1.88 (25H、m)、1.98-2.48 (10H、m)、3.58 (1H、t、J=8.7Hz)。

Mass (FAB) : 461 (M+1)。

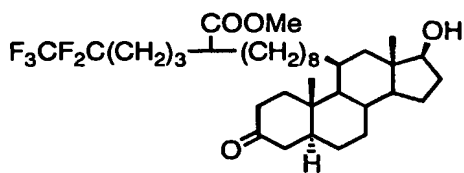
Rf値 (シリカゲルプレート、展開溶媒 ; 酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 2) : 0.086。

10 実施例75と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	Z	分子量	質量分析
76	6	H	432	433 (FAB)
77	7	H	446	447 (FAB)
78	10	H	488	489 (FAB)
79	8	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	620	621 (ESI)

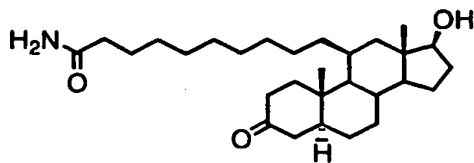
[実施例80]



分子量634、Mass (ESI) : 635 (M+1)

15

[実施例81]



17β-ヒドロキシ-11β-(9-アミノカルボニルノニル)-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

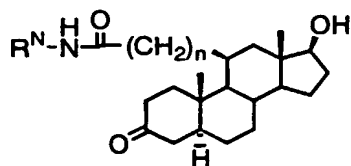
実施例75で得られた17β-ヒドロキシ-11β-(9-カルボキシノニル)-5α-アンドロスタン-3-オン(16.6mg)をテトラヒドロフラン(1ml)に溶解し、-10℃にてトリエチルアミン(6.0μl)及びクロロ炭酸エチル(4.0μl)を加え、10分間攪拌した。反応液中にアンモニアガスを5分間吹き込み、-10℃にて20分間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、室温に戻した。酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒、メタノール:クロロホルム=1:20)で精製して目的物15.5mg(収率94%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(270MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.85(3H, s)、0.88-1.05(4H, m)、1.15(3H, s)、1.10-1.88(25H, m)、1.97-2.50(10H, m)、3.58(1H, t, J=8.7Hz)、5.34(2H, brs)。

Mass(FAB): 460(M+1)。

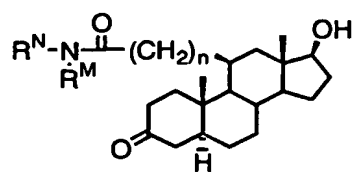
Rf値(シリカゲルプレート、展開溶媒;メタノール:クロロホルム=1:10): 0.33。

実施例81と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



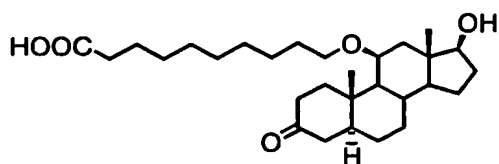
実施例	n	R <sup>N</sup>	分子量	Mass
82	9	n-pentyl	529	530 (FAB)
83	11	H	487	488 (FAB)
84	11	n-pentyl	557	558 (FAB)

実施例 9 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	R <sup>M</sup>	R <sup>N</sup>	分子量	Mass
85	7	Me	Me	459	460 (FAB)
86	7	H	Me	445	446 (FAB)
87	7	Me	Et	473	474 (FAB)
88	7	Me	n-Pr	487	488 (FAB)
89	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		501	502 (FAB)
90	8	Me	Me	473	474 (FAB)
91	8	H	Me	459	460 (FAB)
92	8	Me	Et	487	488 (ESI)
93	8	Me	n-Pr	501	502 (FAB)
94	8	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		515	516 (FAB)
95	9	Me	Me	487	488 (ESI)
96	9	Et	Et	515	516 (ESI)
97	9	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		527	528 (ESI)
98	9	H	Bn	549	550 (ESI)
99	9	Me	n-Bu	529	530 (ESI)
100	9	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	503	504 (ESI)

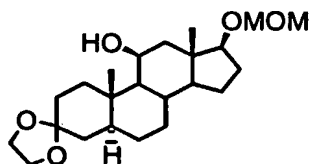
[実施例 101]



5

17β-ヒドロキシ-11β-(9-カルボキシノニルオキシ)-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

(第 1 工程)



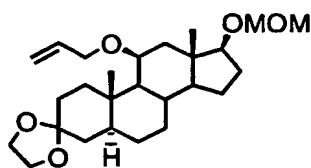
3, 3-エチレンジオキシ-11 $\beta$ -ヒドロキシ-17 $\beta$ -(メトキシメトキシ)-5 $\alpha$ -アンドロスタン

3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -(メトキシメトキシ)-5 $\alpha$ -アンドロ  
 5 スタン-11-オン (2.84 g) をジエチルエーテル (500 ml) に溶解し、  
 水素化アルミニウムリチウム (548 mg) を加え、アルゴン雰囲気下、2時  
 間加熱還流した。反応液を0℃に冷却し、水を加え、セライト濾過した。酢酸エ  
 チルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し  
 、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残さをシリカゲルカラムクロマ  
 10 トグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 2) で精製して目的  
 物 2.68 g (収率94%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  : 0.75-0.99 (3H, m)、1.01 (3H, s)、1.06 (3H, s)、1.20-1.92 (1  
 6H, m)、1.94-2.07 (2H, m)、3.35 (3H, s)、3.4  
 9 (1H, t, J=8.3 Hz)、3.94 (4H, s)、4.29-4.36  
 15 (1H, m)、4.61 (2H, s)。

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒 ; メタノール : クロロホルム = 1 : 5  
 0) : 0.31。

(第2工程)



20 3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -(メトキシメトキシ)-11 $\beta$ -(2-  
 プロペン-1-イルオキシ)-5 $\alpha$ -アンドロスタン

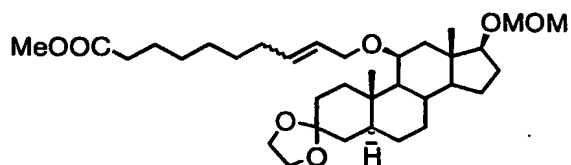
アルゴン雰囲気下、3, 3-エチレンジオキシ-11 $\beta$ -ヒドロキシ-17 $\beta$ -  
 -(メトキシメトキシ)-5 $\alpha$ -アンドロスタン (953.9 mg) をN, N-ジ  
 メチルホルムアミド (10 ml) に溶解し、水素化ナトリウム (60% i  
 25 n oil) (486.7 mg) を加え、50℃にて3時間攪拌した。25℃に戻し  
 た後、臭化アリル (2.20 ml) 及びヨウ化テトラ-n-ブチルアンモニウム

(208.5mg)を加え、50℃にて3時間攪拌した。反応液を0℃に冷却し、水を加えた。酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン=1  
5 : 5）で精製して目的物684.5mg（収率65%）を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.74-0.93 (3H, m)、0.95 (3H, s)、1.03 (3H, s)、1.18-2.09 (16H, m)、2.32 (1H, dd, J=2.9, 14.4Hz)、3.36 (3H, s)、3.47 (1H, t, J=8.3Hz)、3.70 (1H, dd, J=7.2, 16.2Hz)、3.77-3.83 (1H, m)、3.93 (4H, s)、4.10 (1H, dd, J=7.2, 16.2Hz)、4.63 (2H, AB-q)、5.08 (1H, split-d, J=10.6Hz)、5.25 (1H, dd, J=1.7, 17.2Hz)、5.83-6.00 (1H, m)。

15 Rf値（シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン=1：2）：0.59。

（第3工程）



20 3, 3-エチレンジオキシ-17β-(メトキシメトキシ)-11β-(9-メトキシカルボニル-2-ノネン-1-イルオキシ)-5α-アンドロスタン

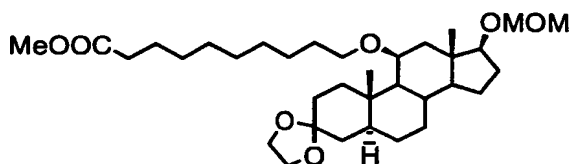
3, 3-エチレンジオキシ-17β-(メトキシメトキシ)-11β-(2-プロペン-1-イルオキシ)-5α-アンドロスタン (18.9mg) をジクロロメタン (0.5ml) に溶解し、メチル 8-ノネノエート (14.8mg) 及びベンジリデンビス (トリシクロヘキシルホスフィン) -ジクロロルテニウム (25 2.0mg) を加え、アルゴン雰囲気下、4時間加熱還流した。放冷後、減圧下濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、酢酸エチル：n

ーヘキサン=1:5)で精製して目的物15.5mg(収率62%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (270MHz、 $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.70-0.95 (3H, m)、0.95 (3H, s)、1.02 (3H, s)、1.15-1.86 (2  
3H, m)、1.93-2.08 (3H, m)、2.30 (3H, t,  $J=7.6$   
5 Hz)、3.36 (3H, s)、3.46 (1H, t,  $J=8.7$  Hz)、3.  
64 (1H, dd,  $J=5.0, 11.3$  Hz)、3.67 (3H, s)、3.  
74-3.80 (1H, m)、3.93 (4H, s)、4.02 (1H, dd  
、 $J=5.0, 11.3$  Hz)、4.63 (2H, AB-q)、5.44-5.  
69 (1H, m)。

10 Rf値(シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル:n-ヘキサン=1:4)  
): 0.26。

(第4工程)



15 3, 3-エチレンジオキシ-17β-(メトキシメトキシ)-11β-(9-  
メトキシカルボニルノニルオキシ)-5α-アンドロスタン

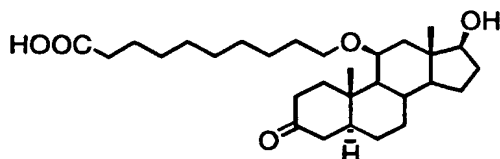
3, 3-エチレンジオキシ-17β-(メトキシメトキシ)-11β-(9-  
メトキシカルボニル-2-ノネン-1-イルオキシ)-5α-アンドロスタン (17.2mg) を酢酸エチル (3ml) に溶解し、10%-パラジウム/炭素 (6.5mg) を加え、水素雰囲気下、25℃にて1時間攪拌した。反応液を濾過  
20 し、減圧下溶媒を留去して、残さ16.7mgを得た。また、別に、3, 3-エ  
チレンジオキシ-17β-(メトキシメトキシ)-11β-(9-メトキシカル  
ボニル-2-ノネン-1-イルオキシ)-5α-アンドロスタン (32.1mg)  
) を酢酸エチル (6ml) に溶解し、10%-パラジウム/炭素 (6.5mg)  
を加え、水素雰囲気下、25℃にて1時間攪拌した。反応液を濾過し、減圧下溶  
25 媒を留去して、残さ30.1mgを得た。これら2つの残さを合わせてシリカゲ  
ルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:2)

で精製して目的物 44. 7 mg (収率 90%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (270 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.71–0.94 (3H, m), 0.94 (3H, s), 1.02 (3H, s), 1.20–2.07 (30H, m), 2.30 (3H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 3.07 (1H, dt,  $J=5.7, 8.4\text{ Hz}$ ), 3.36 (3H, s), 3.43–3.58 (2H, m), 3.67 (3H, s), 3.68–3.74 (1H, m), 3.93 (4H, s), 4.63 (2H, AB-q)。

Rf 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル: n-ヘキサン=1:2) : 0.55。

10 (第5工程)



17β-ヒドロキシ-11β-(9-カルボキシノニルオキシ)-5α-アンドロスタン-3-オン

3, 3-エチレンジオキシ-17β-(メトキシメトキシ)-11β-(9-メトキシカルボニルノニルオキシ)-5α-アンドロスタン (21.0 mg) をアセトン (2 ml) に溶解し、1 N-塩酸 (0.5 ml) を加え、10 時間加熱還流した。反応液に水を加え、ジクロロメタンにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去し、残さ 20.6 mg を得た。また、これとは別に、3, 3-エチレンジオキシ-17β-(メトキシメトキシ)-11β-(9-メトキシカルボニルノニルオキシ)-5α-アンドロスタン (22.0 mg) をアセトン (2 ml) に溶解し、1 N-塩酸 (0.5 ml) を加え、10 時間加熱還流した。反応液に水を加え、ジクロロメタンにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去し、残さ 21.6 mg を得た。これら 2 つの残さを合わせてシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル: n-ヘキサン=1:1) で精製して目的物 29.3 mg (収率 70%) を得た。

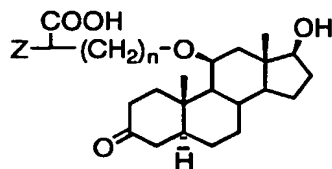
1H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.74 (1H, dd, J=3.3, 10.9Hz), 0.85-0.98 (3H, m), 0.94 (3H, s), 1.24 (3H, s), 1.26-1.72 (22H, m), 1.79-2.14 (5H, m), 2.25-2.57 (6H, m), 3.10 (1H, dt, J=6.1, 8.8Hz), 3.53-3.63 (2H, m), 3.71-3.78 (1H, m)。

Mass (FAB): 477 (M+1)。

Rf値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル: n-ヘキサン=1:1) : 0.12。

10

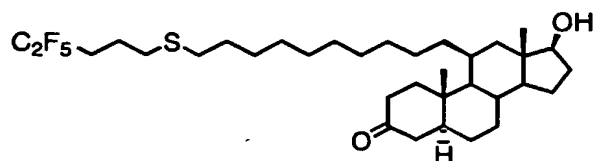
実施例101と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	Z	分子量	Mass (FAB)
102	4	H	420	421
103	6	H	448	449
104	9	H	490	491
105	10	H	504	505
106	12	H	532	533
107	22	H	672	673
108	8	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	636	637

[実施例109]

15 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -(10-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルファニル)デシル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オンの合成



実施例75の第5工程で得られた3,3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -(メト



キシメトキシ) - 11 $\beta$  - (9 - メトキシカルボニルノニル) - 5 $\alpha$  - アンドロ  
スタン (64.8 mg) をテトラヒドロフラン (3 ml) に溶解し、水素化ホウ  
素リチウム (11 mg) を加え、25℃にて4時間攪拌した。反応液に水素化ト  
リエチルホウ素リチウム (1.0 M - テトラヒドロフラン溶液、100  $\mu$ l) を  
5 加え、25℃にて4時間攪拌した。反応液に水素化ホウ素リチウム (20 mg)  
を加え、25℃にて15時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出  
した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、  
減圧下溶媒を留去した。得られた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展  
開溶媒、酢酸エチル : n - ヘキサン = 1 : 4 ~ 1 : 2) で精製して油状物質 6  
10 3.8 mg を得た。この油状物質をジクロロメタン (2 ml) に溶解し、0℃に  
てトリエチルアミン (30  $\mu$ l) 及び塩化メタンスルホン (15  $\mu$ l) を加え  
、25℃にて4時間攪拌した。反応液を飽和食塩水に注ぎ、ジクロロメタンにて  
抽出した。有機層を硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留  
去した。得られた残さをアセトン (3 ml) に溶解し、ヨウ化ナトリウム (30  
15 0 mg) を加え、25℃にて15時間攪拌した。反応液に飽和亜硫酸ナトリウム  
水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸  
マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。残さをシリカゲ  
ルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル : n - ヘキサン = 1 : 4)  
で精製して油状物質 53.9 mg を得た。この油状物質及び 1 - (アセチルスル  
20 ファニル) - 4, 4, 5, 5, 5 - ペンタフルオロペンタン (45 mg) を、メ  
タノール (1 ml) 及びテトラヒドロフラン (0.5 ml) に溶解し、1 N - ナ  
トリウムメトキシド - メタノール溶液 (0.18 ml) を加え、25℃にて15  
時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩  
水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去し  
25 た。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル : n -  
ヘキサン = 1 : 4) で精製して油状物質 66.3 mg を得た。この油状物質をア  
セトン (2 ml) に溶解し、1 N - 塩酸 (0.5 ml) を加え、36時間加熱還  
流した。放冷後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて  
洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。残

さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン=1：4）で精製して目的物52.9mg（収率74%）を得た。

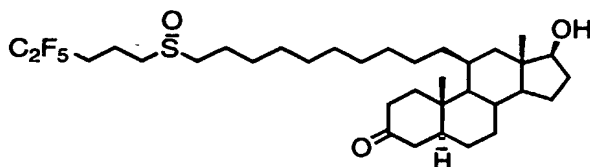
<sup>1</sup>H-NMR（270MHz、CDCl<sub>3</sub>）δ：0.85（3H、s）、0.89-1.09（3H、m）、1.15（3H、s）、1.18-1.74（28H、m）、1.80-2.45（13H、m）、2.51（2H、t、J=7.4Hz）、2.59（2H、t、J=6.9Hz）、3.51-3.62（1H、m）。

Mass（FAB）：623（M+1）。

Rf値（シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン=1：4）：0.19。

#### [実施例110]

17β-ヒドロキシ-11β-(10-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)デシル)-5α-アンドロスタン-3-オンの合成



実施例109で得られた17β-ヒドロキシ-11β-(10-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルファニル)デシル)-5α-アンドロスタン-3-オン（20.5mg）をテトラヒドロフラン（0.8ml）に溶解し、0℃にてOXONE（登録商標、12.4mg）及び水（0.4ml）を加え、0℃にて2時間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、室温に戻した後、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン=1：2～1：1～2：1）で精製して目的物19.5mg（収率93%）を得た。

<sup>1</sup>H-NMR（270MHz、CDCl<sub>3</sub>）δ：0.85（3H、s）、0.86-1.05（3H、m）、1.15（3H、s）、1.10-1.90（2

7H、m)、1.95-2.50 (13H、m)、2.60-2.82 (4H、m)、3.57 (1H、t、J=8.2Hz)。

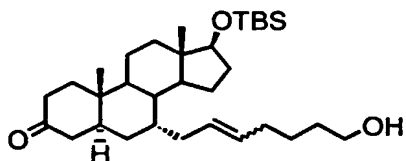
Mass (FAB) : 639 (M+1)。

Rf値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン=1：4)  
5 ) : 0.056。

[実施例111]

17β-ヒドロキシ-7α-(7-ヒドロキシヘプチル)-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

10 (第1工程)



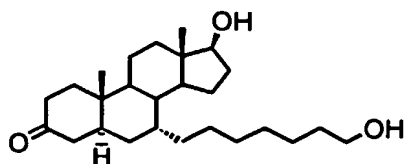
17β-t-ブチルジメチルシリルオキシ-7α-(7-ヒドロキシ-2-ヘプテン-1-イル)-5α-アンドロスタン-3-オン

17β-t-ブチルジメチルシリルオキシ-7α-(2-プロペン-1-イル)  
15 )-5α-アンドロスタン-3-オン (33.4mg) をジクロロメタン (0.5ml) に溶解し、5-ヘキセン-1-オール (20.0mg) 及びベンジリデンビス (トリシクロヘキシルホスフィン) -ジクロロルテニウム (5.2mg) を加え、アルゴン雰囲気下、2時間加熱還流した。放冷後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン=1：4) で精製して  
20 目的物 19.7mg (収率51%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270MHz、CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.01 (6H、s)、0.72 (3H、s)、0.88 (9H、s)、1.04 (3H、s)、0.90-2.10 (27H、m)、2.20-2.47 (3H、m)、3.54 (1H、t、J=8.6Hz)、3.63 (2H、t、J=6.8Hz)、5.19-5.42 (2H、m)。  
25

Rf値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン=1：4)  
) : 0.13。

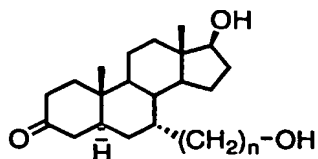
(第2工程)



17β-ヒドロキシ-7α-(7-ヒドロキシヘプチル)-5α-アンドロスタン-3-オン

- 5 17β-t-ブチルジメチルシリルオキシ-7α-(7-ヒドロキシ-2-ヘプテン-1-イル)-5α-アンドロスタン-3-オン (19.6 mg) を酢酸エチル (10 ml) に溶解し、10%-パラジウム/炭素 (6.3 mg) を加え、水素雰囲気下、25℃にて1時間攪拌した。反応液を濾過後、減圧下にて溶媒を留去し、得られた残さをアセトン (2 ml) に溶解し、2N-塩酸 (0.5 ml) を加え、25℃にて2時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン=1：2～1：1) で精製して目的物 15.0 mg (収率98%) を得た。
- 15 <sup>1</sup>H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.76 (3H, s)、1.04 (3H, s)、0.80-1.83 (29H, m)、1.95-2.15 (3H, m)、2.22-2.47 (3H, m)、3.60-3.70 (3H, m)。
- Mass (ESI) : 405 (M+1)。
- 20 R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1) : 0.24。

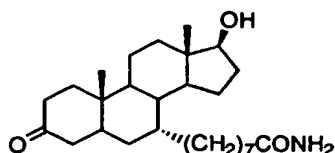
実施例 111 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	分子量	Mass (ESI)
-----	---	-----	------------

1 1 2	8	4 1 8	4 1 9
1 1 3	9	4 3 2	4 3 3

## [実施例 1 1 4]

17β-ヒドロキシ-7α-(7-カルバモイルヘプチル)-5α-アンドロ5 スタン-3-オンの合成

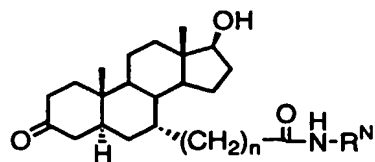
実施例 3 で得られた 17β-ヒドロキシ-7α-(7-カルボキシヘプチル)-5α-アンドロスタン-3-オン (12.6 mg) をテトラヒドロフラン (0.5 ml) に溶解し、0℃でトリエチルアミン (8.1 μl) 及びクロロギ酸エチル (4.2 μl) を滴下した。5 分間攪拌後、アンモニアガスを 30 秒間バブリングした。30 分間攪拌後、反応液に水を加えジクロロメタンで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、ジクロロメタン : メタノール = 20 : 1) で精製して、目的物 11.6 mg (92%) を得た。

1H-NMR (270 MHz、CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.76 (3H, s)、1.04 (3H, s)、1.00-1.83 (27H, m)、1.94-2.16 (3H, m)、2.20-2.50 (5H, m)、3.65 (1H, t、J=8.4 Hz)、5.34-5.54 (2H, m)。

Mass (FAB) : 432 (M+1)。

Rf 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒 ; ジクロロメタン : メタノール = 20 : 1) : 0.48。

実施例 1 1 4 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。

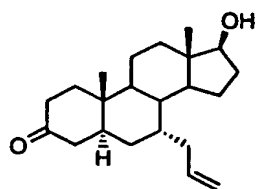


実施例	n	R <sup>N</sup>	分子量	Mass (FAB)
115	5	H	403	404
116	5	n-pentyl	473	474
117	7	n-pentyl	501	502
118	9	H	459	460
119	9	n-pentyl	529	529
120	11	H	487	487
121	11	n-pentyl	557	557
122	13	H	515	515
123	13	n-pentyl	585	585

## [実施例 124]



- 5 17β-ヒドロキシ-7α-{13-(4,4,5,5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)トリデシル}-5α-アンドロスタン-3-オンの合成  
(第1工程)



17β-ヒドロキシ-7α-(2-プロペン-1-イル)-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

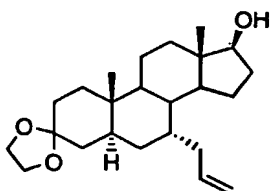
- 10 17β-t-ブチルジメチルシリルオキシ-7α-(2-プロペン-1-イル)-5α-アンドロスタン-3-オン (170mg) をアセトン (2ml) に溶解し、2N-塩酸 (0.5ml) を滴下した。25℃にて4時間攪拌後、反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去し、目的物 126mg (100%)  
15 ) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.77 (3H, s), 1.

0.4 (3H, s)、0.96–2.44 (23H, m)、3.60–3.70 (1H, m)、4.94 (1H, d,  $J=3.5$  Hz)、5.00 (1H, s)、5.58–5.72 (1H, m)。

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1)  
5 : 0.54。

(第2工程)



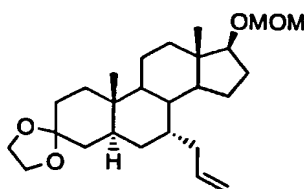
3,3-エチレンジオキシ-17β-ヒドロキシ-7α-(2-プロペン-1-イル)-5α-アンドロスタンの合成

10 17β-ヒドロキシ-7α-(2-プロペン-1-イル)-5α-アンドロスタン-3-オン (126mg) のベンゼン溶液 (5ml) に、エチレングリコール (2ml) 及びp-トルエンスルホン酸 (13.2mg) を加え、Dean-Starkトラップで連続的に水を除きながら加熱環流した。2時間後、氷冷下に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽  
15 和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去し、目的物141mg (収率99%) を得た。

1H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.74 (3H, s)、0.85 (3H, s)、0.92–2.20 (23H, m)、3.56–3.70 (1H, m)、3.93 (4H, s)、4.92–5.04 (2H, m)、5.6  
20 2–5.80 (1H, m)。

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1)  
) : 0.60。

(第3工程)



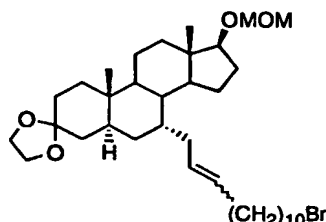
3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-7α-(2-プロペン-1-イル)-5α-アンドロスタンの合成

3, 3-エチレンジオキシ-17β-ヒドロキシ-7α-(2-プロペン-1-イル)-5α-アンドロスタン (141mg) のジクロロメタン溶液 (4ml) に、氷冷下、ジイソプロピルエチルアミン (0.227ml) 及びクロロメチルメチルエーテル (0.087ml) を滴下した。25℃にて14時間攪拌後、反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、ジクロロメタンにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン=1：4) で精製して目的物131mg (収率8-3%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.77 (3H, s)、0.84 (3H, s)、0.92-2.20 (23H, m)、3.35 (3H, s)、3.53 (1H, t, J=8.3Hz)、3.92 (4H, s)、4.62 (2H, d, J=1.8Hz)、4.92-5.04 (2H, m)、5.62-5.80 (1H, m)。

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン=1：4) : 0.50。

(第4工程)



3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-7α-(13-ブromo-2-トリデセン-1-イル)-5α-アンドロスタンの合成

3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-7α-(2-プロペ

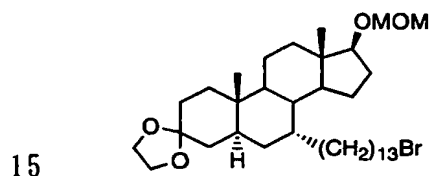


ン-1-イル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン(42.6mg)をジクロロメタン(1.5ml)に溶解し、12-ブロモドデセン(50.4mg)及びベンジリデンビス(トリシクロヘキシルホスフィン)-ジクロロルテニウム(8.4mg)を加え、アルゴン雰囲気下、5時間加熱還流した。放冷後、シリカゲルカラムクロ  
5 マトグラフィー(展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10)で精製して  
目的物56.0mg(収率86%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(270MHz、CDCl<sub>3</sub>) $\delta$ :0.76(3H、s)、0.83(3H、s)、0.94-2.14(41H、m)、3.34(3H、s)、3.41(2H、t、J=6.9Hz)、3.52(1H、t、J=8.3Hz)、3.92(4H、s)、4.62(2H、d、J=1.8Hz)、5.22-5.46(2H、m)。

R<sub>f</sub>値(シリカゲルプレート、展開溶媒;酢酸エチル:n-ヘキサン=1:4):0.56。

(第5工程)



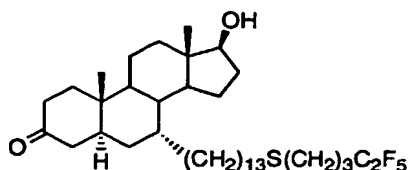
### 3,3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-7 $\alpha$ -(13-ブロモトリデシル)-5 $\alpha$ -アンドロスタンの合成

3,3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-7 $\alpha$ -(13-ブromo-2-トリデセン-1-イル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン(55.3mg)を酢  
20 酸エチル(2ml)に溶解し、10%-パラジウム/炭素(10mg)を加え、  
水素雰囲気下、25℃にて13時間攪拌した。反応液を濾過、減圧下にて溶媒を  
留去して目的物47.4mg(86%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(270MHz、CDCl<sub>3</sub>) $\delta$ :0.76(3H、s)、0.84(3H、s)、0.94-2.10(45H、m)、3.34(3H、s)、3.41(2H、t、J=6.9Hz)、3.53(1H、t、J=8.3Hz)、3.93(4H、s)、4.62(2H、d、J=1.8Hz)。

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：4)  
 )：0.56。

(第6工程)



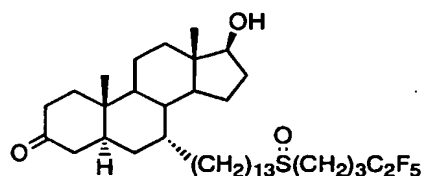
- 5     17β-ヒドロキシ-7α-{13-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロ  
ペンチルスルファニル)トリデシル}-5α-アンドロスタン-3-オンの合成  
 4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンタンチオアセテート (35.0 mg)  
 )をメタノール (1 ml) に溶解し、1 M ナトリウムメチラート/メタノール溶  
 液 (0.12 ml) を滴下した。30 分間攪拌後、反応液に、3,3-エチレン  
 10 ジオキシ-17β-メトキシメトキシ-7α-(13-ブロモトリデシル)-5  
 α-アンドロスタン (47.4 mg) のテトラヒドロフラン (1 ml) 溶液を加  
 えた。18 時間攪拌後、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽  
 和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去し  
 た。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサ  
 15 ン＝1：10) で粗精製し、得られた3,3-エチレンジオキシ-17β-メト  
 キシメトキシ-7α-{13-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルス  
 ルファニル)トリデシル} アンドロスタン (42.6 mg) をアセトン (2 ml)  
 ) に溶解し、2 N-塩酸 (0.5 ml) を加え、60℃で3時間加熱還流した。  
 0℃に放冷後、水を加えクロロホルムにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗  
 20 淨し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下溶媒を留去した。シリカゲ  
 ルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：4)  
 で精製して目的物 40.2 mg (82%) を得た。

1H-NMR (270 MHz、CDCl<sub>3</sub>) δ：0.76 (3H、s)、1.  
 04 (3H、s)、0.88-2.40 (49H、m)、2.50 (2H、t、  
 25 J=7.3 Hz)、2.59 (2H、t、J=7.9 Hz)、3.58-3.7  
 0 (1H、m)。

R f 値（シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：4）：0.32。

（第7工程）

5 17β-ヒドロキシ-7α-{13-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)トリデシル}-5α-アンドロスタン-3-オンの合成



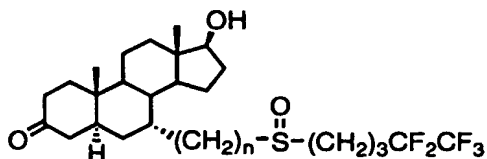
17β-ヒドロキシ-7α-{13-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルファニル)トリデシル}-5α-アンドロスタン-3-オン（26.0mg）をテトラヒドロフラン（1ml）に溶解し、0℃でOXONE（14.4mg）及び水（0.2ml）を加えた。30分間攪拌後、反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン＝2：1）で精製して、目的物19.5mg（73%）を得た。

15 <sup>1</sup>H-NMR（270MHz、CDCl<sub>3</sub>）δ：0.76（3H、s）、1.04（3H、s）、0.98-2.40（49H、m）、2.58-2.82（4H、m）、3.60-3.70（1H、m）。

Mass（FAB）：681（M+1）。

20 R f 値（シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：4）：0.10。

実施例124と同様な方法により、以下の化合物を合成した。

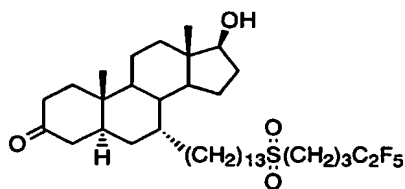


実施例	n	分子量	Mass（FAB）
-----	---	-----	-----------

1 2 5	5	5 6 8	5 6 9
1 2 6	7	5 9 6	5 9 7
1 2 7	9	6 2 4	6 2 5
1 2 8	1 1	6 5 2	6 5 3

## [実施例 1 2 9]

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -{1 3-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフォニル) トリデシル} - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オンの合成



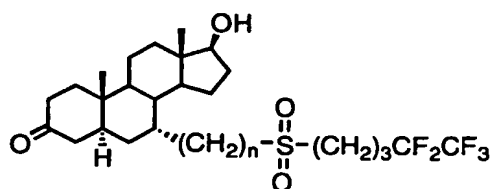
1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -{1 3-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルファニル) トリデシル} - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン (15.0 mg) をテトラヒドロフラン (1 ml) に溶解し、25℃でOXONE (27.8 mg) 及び水 (0.2 ml) を加えた。1時間攪拌後、反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 2) で精製して、目的物 15.0 mg (95%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  : 0.76 (3H, s), 1.04 (3H, s), 0.98-2.40 (49H, m), 2.92-3.08 (4H, m), 3.60-3.70 (1H, m)。

Mass (FAB) : 697 (M+1)。

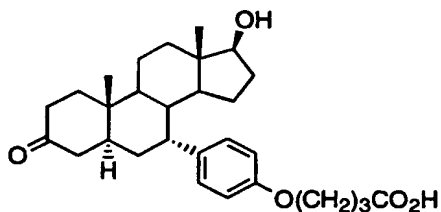
R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒 ; 酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 4) : 0.32。

実施例 1 2 9 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。

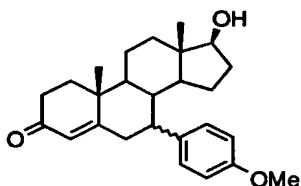


実施例	n	分子量	Mass (FAB)
130	7	612	613
131	9	640	641
132	11	668	669

## [実施例133]



- 5 17β-ヒドロキシ-7α-(4-(3-カルボキシプロポキシ)フェニル)-5α-アンドロスタン-3-オンの合成  
(第1工程)



- 10 17β-ヒドロキシ-7-(4-メトキシフェニル)-5α-アンドロスタン-4-エン-3-オンの合成

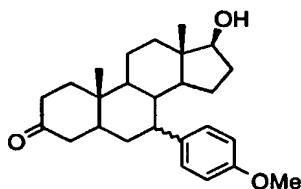
アルゴン雰囲気下、ヨウ化銅(I) (1.14 g) を無水テトラヒドロフラン (5 ml) に溶解し、-50℃にて0.5 M 4-メトキシフェニルマグネシウムブロミド/テトラヒドロフラン溶液 (11.9 ml) を滴下した。10分間攪拌後、-78℃にて17β-t-ブチルジメチルシリルオキシアンドロスター4, 6-ジエン-3-オン (600 mg)、クロトリメチルシラン (0.376 ml)、及びヘキサメチルホスホリクトリアミド (0.518 ml) のテトラヒドロフラン溶液 (6 ml) を滴下した。1時間掛けて-40℃まで昇温した。反

応液に2N-塩酸を加え、25℃にて1時間攪拌後、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン=1：2）で精製して目的物67.9mg（収率12%）をジアステレオマー混合物として得た。

<sup>1</sup>H-NMR（270MHz、CDCl<sub>3</sub>） $\delta$ ：0.55-0.90（4/3H、m）、0.76（2H、s）、0.81（1H、s）、1.00-2.54（47/3H、m）、1.32（2H、s）、1.34（1H、s）、2.82-3.00（2/3H、m）、3.00-3.08（1/3H、m）、3.40-3.56（1H、m）、3.78（1H、s）、3.80（2H、s）、5.71（1H、s）、6.74-6.86（2H、m）、7.04-7.18（2H、m）。

Rf値（シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1）：0.38。

（第2工程）



### 17β-ヒドロキシ-7-(4-メトキシフェニル)-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

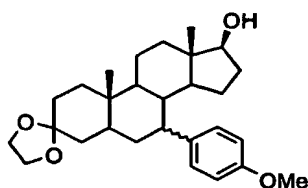
-78℃にて液体アンモニア（15ml）に金属リチウム（11.9mg）を加えた。5分間攪拌した後、17β-ヒドロキシ-7-(4-メトキシフェニル)-5α-アンドロスタン-4-エン-3-オン（67.8mg）及びt-ブタノール（25.3μl）のテトラヒドロフラン（3ml）溶液を加え、5分間攪拌した。1,2-ジブロモエタン（0.1ml）及び塩化アンモニウム（1g）を加え、25℃にて30分間攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン=1：2）で

精製して目的物 49. 8 mg (収率 73%) をジアステレオマー混合物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  (270 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.50–0.62 (2/3 H, m)、0.73 (2H, s)、0.78 (1H, s)、0.84–1.00 (2/3 H, m)、1.11 (1H, m)、1.15 (2H, m)、1.04–2.44 (58/3 H, m)、2.90–3.00 (1/3 H, m)、3.42–3.58 (1H, m)、3.78 (2H, s)、3.79 (1H, s)、6.70–7.30 (4H, m)。

Rf 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル: n-ヘキサン = 1:1) : 0.48。

(第3工程)



### 3, 3-エチレンジオキシー-17β-ヒドロキシ-7-(4-メトキシフェニル)-5α-アンドロスタンの合成

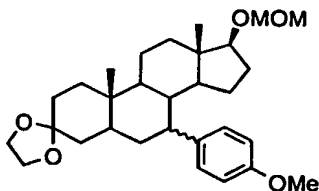
17β-ヒドロキシ-7-(4-メトキシフェニル)-5α-アンドロスタン-3-オン (49.7 mg) をベンゼン (2 ml) に溶解し、エチレングリコール (0.5 ml) 及び p-トルエンスルホン酸 (2.2 mg) を加え、Dean-Stark トラップで連続的に水を除きながら加熱環流した。1 時間後、反応液を 0℃ に冷却し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去し、目的物 55.0 mg (収率 100%) をジアステレオマー混合物として得た。

$^1\text{H-NMR}$  (270 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.54–0.60 (2/3 H, m)、0.70 (2H, s)、0.75 (1H, s)、0.91 (1H, s)、0.95 (2H, s)、0.90–1.98 (58/3 H, m)、2.22–2.38 (2/3 H, m)、2.86–2.94 (1/3 H, m)、3.44

−3.58 (1H, m)、3.72−3.98 (4H, m)、3.78 (2H, s)、3.80 (1H, s)、6.70−7.30 (4H, m)。

Rf値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1)：0.52。

5 (第4工程)



3,3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-7-(4-メトキシフェニル)-5α-アンドロスタンの合成

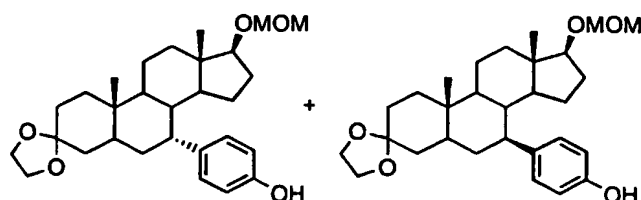
3,3-エチレンジオキシ-17β-ヒドロキシ-7-(4-メトキシフェニル)-5α-アンドロスタン (55.0mg) のジクロロメタン (2ml) 溶液に、0℃でジイソプロピルエチルアミン (0.128ml) 及びクロロメチルメチルエーテル (0.047ml) を滴下した。25℃にて12時間攪拌後、反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、ジクロロメタンにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン=1：4) で精製して目的物56.2mg (収率93%) をジアステレオマー混合物として得た。

1H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ：0.42−0.60 (2/3H, m)、0.74 (2H, s)、0.78 (1H, s)、0.80−0.90 (2/3H, m)、0.91 (1H, s)、0.94 (2H, s)、1.00−1.96 (56/3H, m)、2.22−2.36 (2/3H, m)、2.84−2.92 (1/3H, m)、3.30 (3H, s)、3.34−3.44 (1H, m)、3.78 (2H, s)、3.80 (1H, s)、3.82−3.98 (4H, m)、4.56 (2H, s)、6.70−7.30 (4H, m)。

25 Rf値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1)：0.68。



## (第5工程)



3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-7α-(4-ヒドロキシフェニル)-5α-アンドロスタン及び3, 3-エチレンジオキシ-17β-  
 5 メトキシメトキシ-7@-(4-ヒドロキシフェニル)-5α-アンドロスタンの合成

3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-7-(4-メトキシフェニル)-5α-アンドロスタン (151mg) のN, N-ジメチルアセトアミド (3ml) 溶液に、ナトリウムチオメチラート (109mg) を加え、加熱  
 10 環流した。3時間後、反応液を0℃に冷却し、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:4) で精製して、目的物の7α体42.3mg (収率29%) 及び7@体88.0mg (収率60%) を得た。

15 3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-7α-(4-ヒドロキシフェニル)-5α-アンドロスタン;

<sup>1</sup>H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.78 (3H, s), 0.90 (3H, s), 1.00-2.08 (20H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 3.30 (3H, s), 3.38 (1H, t, J=8.6Hz),  
 20 3.80-3.94 (4H, m), 4.56 (2H, s), 4.64 (1H, s), 6.72 (2H, d, J=8.4Hz), 7.23 (2H, d, J=8.4Hz)。

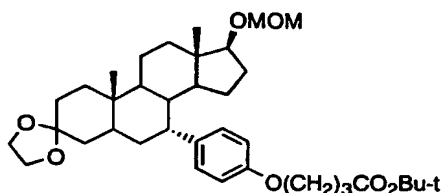
R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル:n-ヘキサン=1:4): 0.20。

25 3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-7@-(4-ヒドロキシフェニル)-5α-アンドロスタン;

1H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.46-0.60 (1H, m), 0.73 (3H, s), 0.94 (3H, s), 0.82-1.96 (19H, m), 2.22-2.34 (1H, m), 3.30 (3H, s), 3.38 (1H, t, J=8.6Hz), 3.93 (4H, brs), 4.56 (2H, s), 4.68 (1H, s), 6.66 (1H, dd, J=2.3, 8.2Hz), 6.74 (1H, dd, J=2.3, 8.2Hz), 6.92 (1H, dd, J=1.8, 8.2Hz), 7.07 (1H, dd, J=1.8, 8.2Hz)。

Rf値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル: n-ヘキサン=1:4)  
: 0.28。

(第6工程)



3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-7 $\alpha$ -(4-(3-tert-ブトキシカルボキシプロポキシ)フェニル)-5 $\alpha$ -アンドロスタンの合成

3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-7 $\alpha$ -(4-ヒドロキシフェニル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン (22.0mg) のN, N-ジメチルアセトアミド溶液 (0.5ml) に、25℃で4-ブロモ酪酸t-ブチル (31.3mg)、炭酸カリウム (64.5mg) 及び18-クラウン-6 (123mg) を加えた。1時間後、反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル: n-ヘキサン=1:8) で精製して目的物 27.8mg (収率99%) を得た。

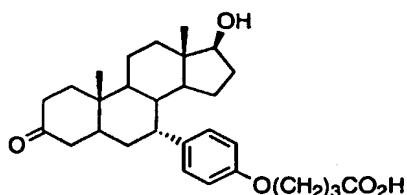
1H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.78 (3H, s), 0.90 (3H, s), 1.04-2.12 (22H, m), 1.46 (9H, s), 2.43 (2H, t, J=7.3Hz), 2.82-2.92 (1H, m), 3.30 (3H, s), 3.38 (1H, t, J=8.4Hz), 3.80-3

9.4 (4H, m)、3.97 (2H, t,  $J=6.1$  Hz)、4.56 (2H, s)、6.78 (2H, d,  $J=8.6$  Hz)、7.26 (2H, d,  $J=8.6$  Hz)。

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン=1：4)

5 : 0.40。

(第7工程)



17β-ヒドロキシ-7α-[4-(3-カルボキシプロポキシ)フェニル]-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

10 3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-7α-(4-(3-メトキシカルボニルプロポキシ)フェニル)-5α-アンドロスタン (27.6 mg) をアセトン (2 ml) に溶解し、2N-塩酸 (0.5 ml) を加えて、60℃で加熱した。2時間後、反応液に水を加え、ジクロロメタンにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、ジクロロメタン：メタノール=10：1) で精製して目的物 19.2 mg (収率 89%) を得た。

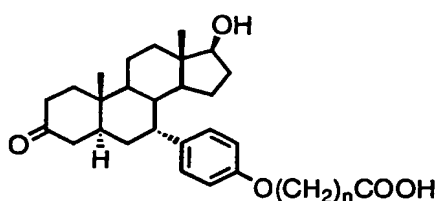
1H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.78 (3H, s)、1.10 (3H, s)、1.00-2.44 (22H, m)、2.60 (2H, t,  $J=7.3$  Hz)、2.88-2.96 (1H, m)、3.50 (1H, t,  $J=8.2$  Hz)、4.00 (2H, t,  $J=5.9$  Hz)、6.77 (2H, d,  $J=8.6$  Hz)、7.20 (2H, d,  $J=8.6$  Hz)。

Mass (FAB) : 469 (M+1)。

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル) : 0.54。

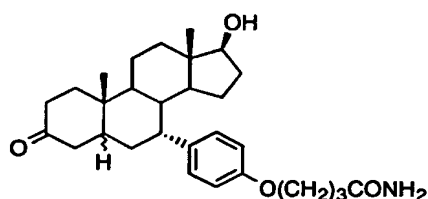
25

実施例 133 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	分子量	Mass (FAB)
134	1	440	441
135	7	524	525

## [実施例 136]



5 17β-ヒドロキシ-7α-{4-(3-カルバモイルプロポキシ)フェニル}-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

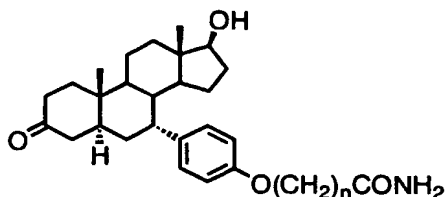
実施例 133 で得られた 17β-ヒドロキシ-7α-{4-(3-カルボキシプロポキシ)フェニル}-5α-アンドロスタン-3-オン (7.3 mg) をテトラヒドロフラン (0.5 ml) に溶解し、氷冷下、トリエチルアミン (3.2 μl) 及びクロロギ酸エチル (1.8 μl) を滴下した。5 分間攪拌後、アンモニアガスを 1 分間バブリングした。15 分間攪拌後、反応液に水を加えジクロロメタンで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。プレパラティブクロマトグラフィー (展開溶媒、ジクロロメタン：メタノール=20：1) で精製して目的物 6.6 mg (収率 90%) を得た。

1H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.78 (3H, s)、1.11 (3H, s)、1.00-2.44 (22H, m)、2.45 (2H, t, J=7.1 Hz)、2.88-2.98 (1H, m)、3.50 (1H, t, J=8.2 Hz)、4.01 (2H, t, J=5.7 Hz)、5.30-5.60 (2H, m)、6.77 (2H, d, J=8.6 Hz)、7.20 (2H, d, J=8.6 Hz)。

Mass (FAB) : 468 (M+1)。

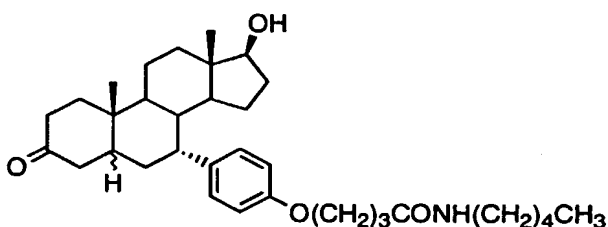
Rf 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒 ; ジクロロメタン : メタノール = 20 : 1) : 0.14。

5 実施例 136 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	分子量	Mass (FAB)
137	1	439	440
138	7	523	524

[実施例 139]



10 17β-ヒドロキシ-7α-4-{3-(N-ペンチルカルバモイル)プロポキシ}フェニル}-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

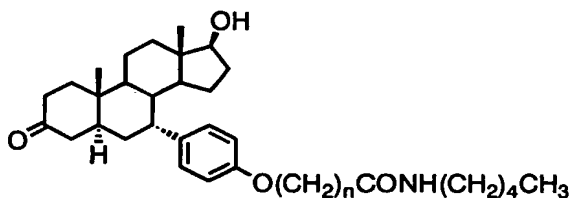
実施例 133 で得られた 17β-ヒドロキシ-7α-{4-(3-カルボキシプロポキシ)フェニル}-5α-アンドロスタン-3-オン (7.0 mg) をテトラヒドロフラン (0.5 ml) に溶解し、25℃で 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (8.6 mg)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール-水合物 (6.8 mg) 及びペンチルアミン (10.4 ml) を加えた。4 時間攪拌後、反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。プレパラティブクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル) で精製して目的物 5.8 mg (収率 72%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (270 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.78 (3H, s), 0.80–0.94 (3H, m), 1.11 (3H, s), 1.00–2.44 (30H, m), 2.88–2.98 (1H, m), 3.24 (2H, dt,  $J=6.1, 7.1\text{ Hz}$ ), 3.50 (1H, t,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 3.99 (2H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 5.50 (1H, brs), 6.77 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.20 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ).

Mass (FAB): 538 ( $M+1$ ).

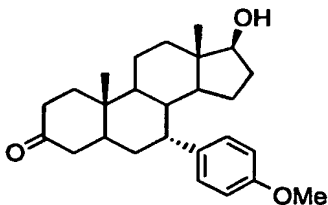
Rf 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル): 0.62.

10 実施例 139 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



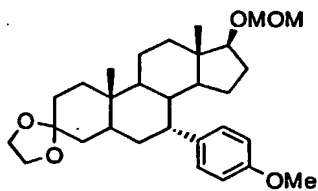
実施例	n	分子量	Mass (FAB)
140	7	593	594

[実施例 141]



15 17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -(4-メトキシフェニル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オンの合成

(第1工程)



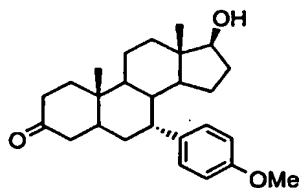
3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-7 $\alpha$ -(4-メトキシフェニル)-5 $\alpha$ -アンドロスタンの合成

実施例136の第5工程で得られた3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-7 $\alpha$ -(4-ヒドロキシフェニル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン (10.0 mg) をN, N-ジメチルホルムアミド (1 ml) に溶解し、0℃で60%水素化ナトリウム (2.5 mg) 及びヨードメタン (13.2  $\mu$ l) を加えた。25℃で13時間攪拌後、反応液に飽和NH<sub>4</sub>Cl水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:4) で精製して目的物10.2 mg (収率99%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.78 (3H, s)、0.91 (3H, s)、1.00-1.96 (20H, m)、2.84-2.92 (1H, m)、3.30 (3H, s)、3.38 (1H, t, J=8.6 Hz)、3.80 (3H, s)、3.82-3.92 (4H, m)、4.56 (2H, s)、6.80 (2H, d, J=8.6 Hz)、7.27 (2H, d, J=8.6 Hz)。

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル:n-ヘキサン=1:1) : 0.68。

(第2工程)



17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -(4-メトキシフェニル) アンドロスタン-3-オンの合成

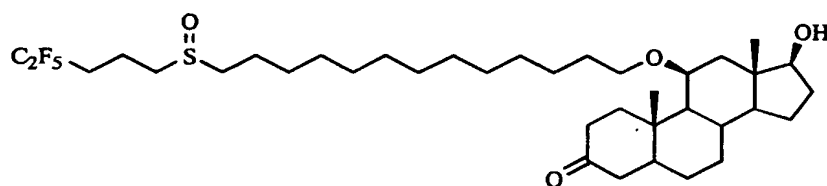
3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-7 $\alpha$ -(4-メトキシフェニル) アンドロスタン (10.2 mg) をアセトン (2 ml) に溶解し、2N-塩酸 (0.5 ml) を加えて、加熱環流した。2時間後、反応液に水を加

え、ジクロロメタンにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィ（展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：1）で精製して目的物7. 2 mg（収率85%）を得た。

- 5  $^1\text{H-NMR}$  (270 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.78 (3H, s), 1.11 (3H, s), 1.00–2.50 (20H, m), 2.88–2.96 (1H, m), 3.50 (1H, t,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 3.79 (3H, s), 6.79 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.22 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ )。
- 10 Mass (FAB): 397 ( $M+1$ )。
- Rf 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：1) : 0.48。

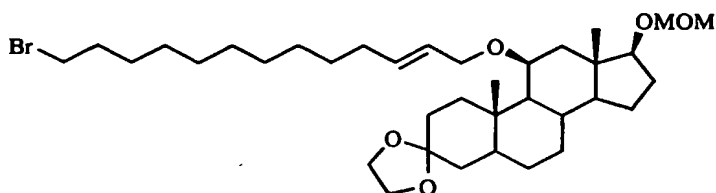
[実施例142]

- 15 17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -{13-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)トリデシルオキシ}-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オンの合成



(第1工程)

- 20 3,3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-11 $\beta$ -(13-プロモ-2-トリデセニルオキシ)-5 $\alpha$ -アンドロスタン





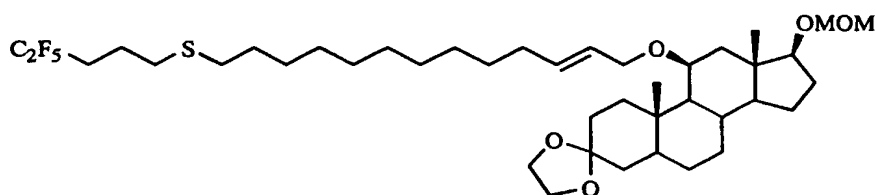
アルゴン雰囲気下、実施例 104 の第 2 工程で得られた 3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -(メトキシメトキシ)-11 $\beta$ -(2-プロペン-1-イルオキシ)-5 $\alpha$ -アンドロスタン (100.8 mg)、12-ブロモドデカン-1-エン (114.7 mg) 及びベンジリデンビストリシクロヘキシルホスフィンジクロルルテニウム (19.1 mg) をトルエン (2.3 ml) に溶解し、110℃にて26時間攪拌した。減圧下に溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:5) で精製して目的物 98.6 mg (収率 65%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.95 (3H, s)、1.02 (3H, s)、0.70-2.38 (38H, m)、3.36 (3H, s)、3.93 (4H, s)、3.31-4.12 (6H, m)、4.56-4.67 (2H, m)、5.38-5.69 (2H, m)。

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル:ヘキサン=1:4): 0.49。

#### (第2工程)

3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-11 $\beta$ -{13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルチオ)-2-トリデセニルオキシ}-5 $\alpha$ -アンドロスタン



窒素雰囲気下、3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-11 $\beta$ -(13-ブromo-2-トリデセニルオキシ)-5 $\alpha$ -アンドロスタン (98.6 mg)、4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンタン-1-チオールアセテート (71.2 mg)、ナトリウムメチラート (1.0 M メタノール溶液) (0.30 ml) をメタノール (1.5 ml)、テトラヒドロフラン (0.8 ml) に溶解し、室温にて11時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶

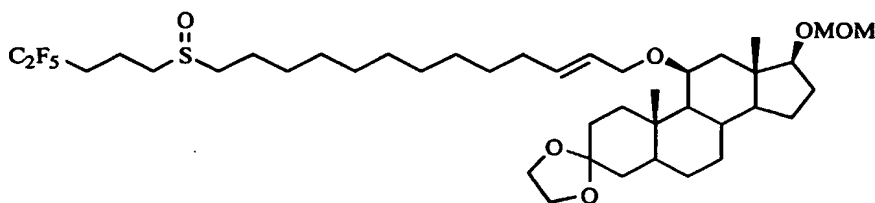
媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、酢酸エチル：  
n-ヘキサン=1：4）で精製して目的物97.3mg（収率84%）を得た。

<sup>1</sup>H-NMR（270MHz、CDCl<sub>3</sub>）δ：0.95（3H、s）、1.02（3H、s）、0.69-2.38（42H、m）、2.50（2H、t、  
J=7.3Hz）、2.59（2H、t、J=6.9Hz）、3.36（3H、  
s）、3.47（1H、t、J=8.2Hz）、3.59-4.17（3H、m）、3.93（4H、s）、4.57-4.68（2H、m）、5.39-5.70（2H、m）。

s R f 値（シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン=1：4）：  
0.42。

（第3工程）

3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-{13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)-2-トリデセニルオキシ}-5α-アンドロスタン



3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-{13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルチオ)-2-トリデセニルオキシ}-5α-アンドロスタン（50.1mg）をテトラヒドロフラン（0.6ml）に溶解し、氷冷下オキソン（20.1mg）、水（0.3ml）を加え、1時間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、酢酸エチル：  
n-ヘキサン=3：2）で精製して目的物29.4mg（収率57%）を得た。

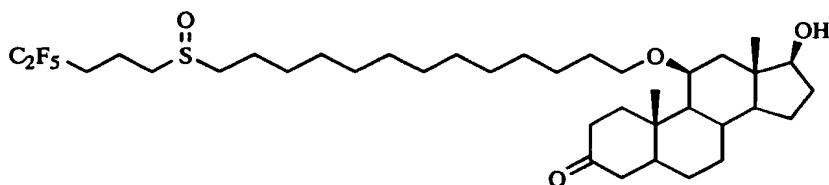
<sup>1</sup>H-NMR（270MHz、CDCl<sub>3</sub>）δ：0.95（3H、s）、1.02（3H、s）、0.70-2.37（42H、m）、2.58-2.82（4H、m）、3.36（3H、s）、3.46（1H、t、J=8.2Hz）、

3. 93 (4H, s)、3. 59–4. 17 (3H, m)、4. 57–4. 68 (2H, m)、5. 35–5. 70 (2H, m)。

Rf 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝1：2)：0. 12。

5 (第4工程)

17β-ヒドロキシ-11β-{13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)トリデシルオキシ}-5α-アンドロスタン-3-オン



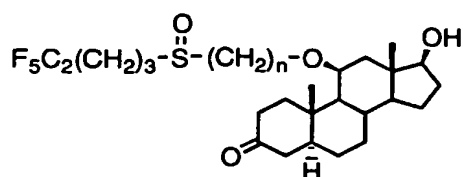
10 3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-{13-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)-2-トリデセニルオキシ}-5α-アンドロスタン (29. 4mg) を酢酸エチル (1ml) に溶解し、10%パラジウム／炭素 (10mg) を加え、室温下、水素雰囲気下3時間攪拌した。反応液を濾過、減圧下にて溶媒を留去して得られた残さをアセトン (2ml) に溶解し、1N-塩酸 (1ml) を加え、3時間加熱還流した。放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン＝2：1) で精製して目的物20. 5mg (収率78%) を得た。

20 <sup>1</sup>H-NMR (270MHz、CDCl<sub>3</sub>) δ：0. 94 (3H, s)、1. 24 (3H, s)、0. 68–2. 54 (47H, m)、2. 58–2. 83 (4H, m)、3. 04–3. 16 (1H, m)、3. 51–3. 63 (2H, m)、3. 72–3. 79 (1H, m)。

Mass (FAB)：697 (M+1)

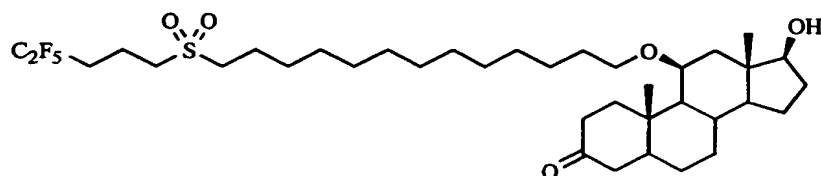
25

実施例142と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



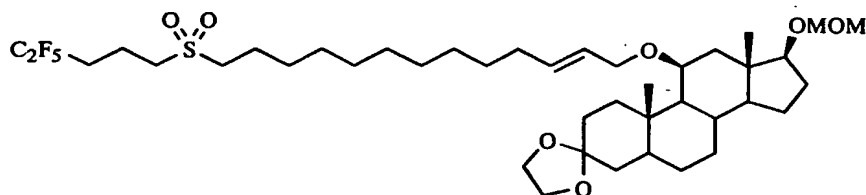
実施例	n	分子量	Mass (FAB)
143	5	584	585
144	7	612	613
145	9	640	641
146	11	668	669

## [実施例147]



- 5 17β-ヒドロキシ-11β-{13-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)トリデシルオキシ}-5α-アンドロスタン-3-オン  
の合成

(第1工程)



- 10 3,3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-{13-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)-2-トリデセニルオキシ}-5α-アンドロスタン

- 3,3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-{13-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルチオ)-2-トリデセニルオキシ}  
15 }-5α-アンドロスタン (47.2mg) をテトラヒドロフラン (0.6ml) に溶解し、室温下OXONE (75.7mg)、水 (0.3ml) を加え、1

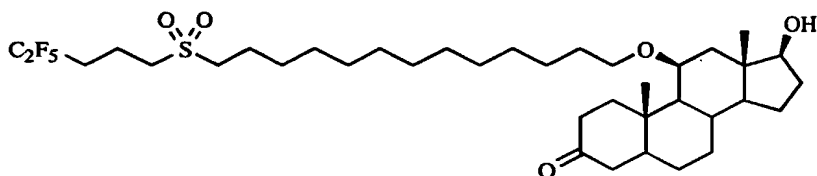
時間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン=1：3）で精製して目的物 33.6 mg（収率 68%）を得た。

5 .

$^1\text{H-NMR}$  (270 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.95 (3H, s), 1.02 (3H, s), 0.70–2.39 (42H, m), 2.92–3.12 (4H, m), 3.36 (3H, s), 3.46 (1H, t,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 3.93 (4H, s), 3.59–4.18 (3H, m), 4.57–4.68 (2H, m), 5.37–5.70 (2H, m)。

Rf 値（シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン=1：2）：0.47。

（第2工程）

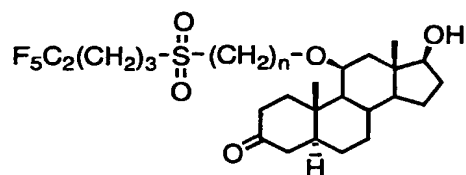


15 17β-ヒドロキシ-11β-{13-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)トリデシロキシ}-5α-アンドロスタン-3-オン  
 3,3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-{13-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)-2-トリデセニロキシ}-5α-アンドロスタン (33.6 mg) を酢酸エチル (1 ml) に溶  
 20 解し、10%パラジウム/炭素 (10 mg) を加え、室温下、水素雰囲気下4時間攪拌した。反応液を濾過、減圧下にて溶媒を留去して得られた残さをアセトン  
 (2 ml) に溶解し、1N-塩酸 (1 ml) を加え、4時間加熱還流した。放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下溶媒を留去し  
 25 た。シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン=2：3）で精製して目的物 22.9 mg（収率 76%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (270MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.94 (3H, s)、1.24 (3H, s)、0.68–2.54 (47H, m)、2.92–3.15 (5H, m)、3.51–3.64 (2H, m)、3.72–3.78 (1H, m)。

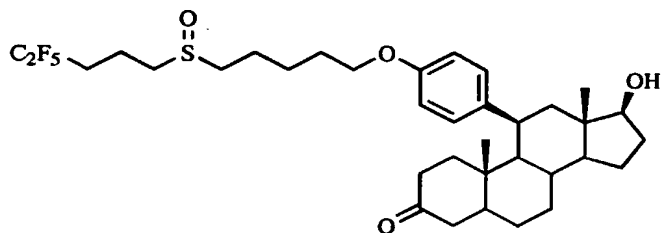
5 Mass (FAB): 713 ( $\text{M}+1$ )

実施例 147 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



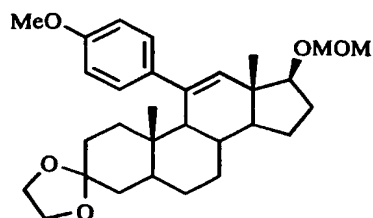
実施例	n	分子量	Mass (FAB)
148	7	628	629
149	9	656	657
150	11	684	685

10 [実施例 151]



17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[4-{5-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ペンチルオキシ}フェニル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オンの合成

15 (第1工程)



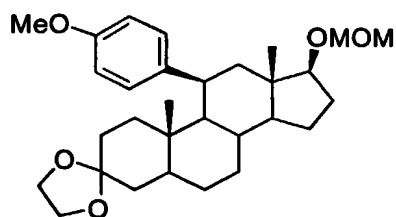
3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-11-(4-メトキシフェニル)-5 $\alpha$ -アンドロスト-11-エン

3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-11-[{(1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ノナフルオロブチル)スルホニル}オキシ]-  
 5 5 $\alpha$ -アンドロスト-11-エン (98.8 mg)、4-メトキシフェニルボロン酸 (223 mg)、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム (6.8 mg)、塩化リチウム (12.4 mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (0.5 ml)、トルエン (2 ml) 及びエタノール (1 ml) の混合物をアルゴン雰囲気下  
 10 13時間加熱還流した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、  
 濾過後、減圧下溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:6) で精製して目的物65.4 mg (収率93%)を得た。

1H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.59-2.28 (18H, m)、0.85 (3H, s)、0.94 (3H, s)、3.31 (3H, s)、  
 15 3.63 (1H, t, J=8.0 Hz)、3.78 (3H, s)、3.80-3.96 (4H, m)、4.57 (1H, d, J=6.6 Hz)、4.61 (1H, d, J=6.6 Hz)、5.86 (1H, d, J=1.7 Hz)、6.68-6.83 (2H, m)、6.95-7.08 (2H, m)。

20 R<sub>f</sub>値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル:ヘキサン=1:4): 0.40。

(第2工程)



3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-11 $\beta$ -(4-メトキシフェニル)-5 $\alpha$ -アンドロスタン

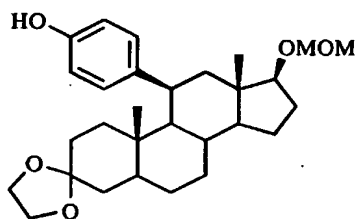
3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-11-(4-メトキシ

シフェニル) - 5 $\alpha$ -アンドロスト-11-エン (29.9mg) を酢酸エチル (2ml) に溶解し、酢酸 (0.2ml)、10%-パラジウム/炭素 (30mg) を加え、水素加圧下 (25atm)、25℃にて3時間攪拌した。反応液を濾過し、減圧下溶媒を留去したのち反応混合物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル:ジクロロメタン=1:20) で精製して目的物 20.1mg (収率67%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 7.40-7.25 (2H, m)、6.75 (2H, d,  $J=8.2\text{Hz}$ )、4.55 (3H, s)、3.92 (4H, s)、3.78 (3H, s)、3.42 (1H, dd,  $J=6.8$ 、6.6Hz)、3.38-3.28 (1H, m)、3.28 (3H, s)、2.40-0.80 (20H, m)、0.76 (3H, s)、0.65 (3H, s)。

Mass (EI): 484 ( $\text{M}^+$ )

(第3工程)



3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-11 $\beta$ -(4-ヒドロキシフェニル) - 5 $\alpha$ -アンドロスタン

3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-11 $\beta$ -(4-メトキシフェニル) - 5 $\alpha$ -アンドロスタン (114.8mg)、ナトリウムメタノチオラート (69.9mg) のジメチルホルムアミド (3ml) 溶液を、窒素雰囲気下、1時間加熱還流した。放冷後、反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル: *n*-ヘキサン=1:2) で精製して目的物 105.2mg (収率94%) を得た。

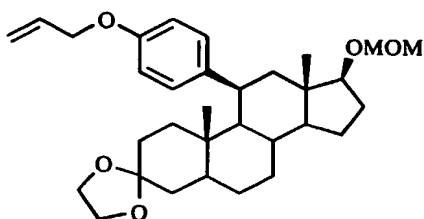
$^1\text{H-NMR}$  (270MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 0.65 (3H, s)、0.



7.5 (3H, s), 0.90–2.19 (20H, m), 3.28 (3H, s), 3.24–3.34 (1H, m), 3.43 (1H, t,  $J=8.1$  Hz), 3.91 (4H, s), 4.54 (2H, s), 4.64 (1H, s), 6.64 (2H, d,  $J=8.7$  Hz), 7.13–7.32 (2H, m)。

5 R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン=1：2)：0.29。

(第4工程)



10 3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-{4-(2-プロペン-1-イルオキシ)フェニル}-5α-アンドロスタン

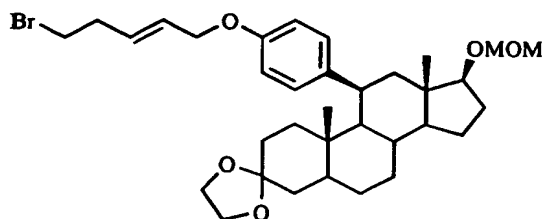
3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-(4-ヒドロキシフェニル)-5α-アンドロスタン (56.2 mg) のジメチルホルムアミド (2 ml) の溶液に、氷冷下、水素化ナトリウム (9.6 mg) を加え、5分間攪拌した。アリルブロミド (28.9 mg) を加え、氷冷下、1時間攪拌した。  
15 た。反応液に水を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル：n-ヘキサン=1：2) で精製して目的物 51.0 mg (収率 84%) を得た。

1H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.65 (3H, s), 0.76 (3H, s), 0.82–2.18 (20H, m), 3.28 (3H, s), 3.24–3.36 (1H, m), 3.43 (1H, t,  $J=8.0$  Hz), 3.90 (4H, s), 4.49 (2H, d,  $J=5.3$  Hz), 4.53 (2H, s), 5.26 (1H, dd,  $J=10.5, 1.2$  Hz), 5.40 (1H, dd,  $J=17.3, 1.5$  Hz), 5.98–6.13 (1H, m), 6.72 (2H, d,  $J=8.7$  Hz), 7.26 (2H, br s)。  
25

R<sub>f</sub> 値 (シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン=1：2)：0

. 59.

(第 5 工程)



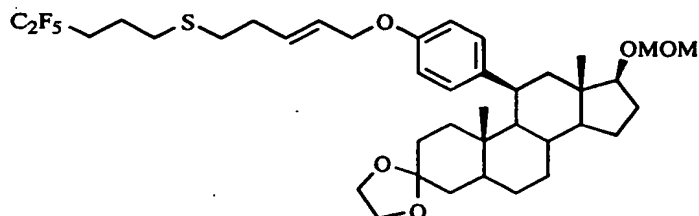
3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-{4-(5  
5-プロモ-2-ペンテン-1-イルオキシ)フェニル}-5α-アンドロスタン

アルゴン雰囲気下、3, 3-エチレンジオキシー-17β-メトキシメトキシ-11β-(4-(2-プロペン-1-イルオキシ)フェニル)-5α-アンドロスタン(16.0mg)、4-プロモ-1-ブテン(8.5mg)、ベンジリデンビストリシクロヘキシルホスフィンジクロルルテニウム(2.6mg)をジクロロメタン(0.3ml)に溶解し、室温下、16.5時間攪拌した。減圧下に溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:4)で精製して目的物14.4mg(収率74%)を得た。

1H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.65 (3H, s), 0.76 (3H, s), 0.81-2.18 (20H, m), 2.60-2.78 (2H, m), 3.28 (3H, s), 3.41 (2H, t, J=6.9Hz), 3.25-3.34 (1H, m), 3.37-3.48 (1H, m), 3.90 (4H, s), 4.43-4.51 (2H, m), 4.54 (2H, s), 5.77-5.88 (2H, m), 6.71 (2H, d, J=8.7Hz), 7.26 (2H, brs)。

20 R f 値（シリカゲルプレート、展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝1：4）：  
0.48。

(第 6 工程)



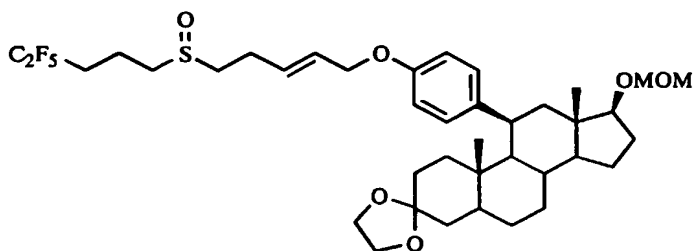
3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-[4-{5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)-2-ペンテニルオキシ}フェニル]-5α-アンドロスタン

窒素雰囲気下、3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-  
 5 {4-(5-ブロモ-2-ペンテン-1-イルオキシ)フェニル}-5α-アン  
 ドロスタン (14.4 mg)、4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンタン-  
 1-チオールアセテート (11.0 mg) 及びナトリウムメチラート (1.0 M  
 メタノール溶液) (0.05 ml) をメタノール (0.2 ml)、テトラヒドロ  
 フラン (0.2 ml) に溶解し、室温にて17時間攪拌した。反応液に水を加え  
 10、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで  
 乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開  
 溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:4) で精製して目的物14.8 mg (収  
 率87%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270 MHz、CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.65 (3H, s)、0.  
 15 75 (3H, s)、0.81-2.49 (26H, m)、2.54-2.67 (4H, m)、3.28 (3H, s)、3.43 (1H, t, J=7.9 Hz)、  
 3.24-3.37 (1H, m)、3.90 (4H, s)、4.45 (2H, d、J=4.8 Hz)、4.53 (2H, s)、5.66-5.94 (2H, m)  
 、6.71 (2H, d、J=8.6 Hz)、7.26 (2H, br s)。

20 Rf値 (シリカゲルプレート、展開溶媒; 酢酸エチル:ヘキサン=1:4):  
 0.48。

(第7工程)



3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-[4-{5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)-2-ペンテ  
 25

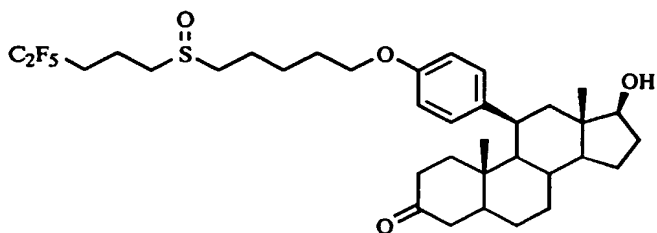
ニルオキシ} フェニル] - 5 $\alpha$ -アンドロスタン

3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-11 $\beta$ -[4-{5-  
 (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)-2-ペンテ  
 5 ニルオキシ} フェニル] - 5 $\alpha$ -アンドロスタン (14. 8mg) をテトラヒドロ  
 フラン (0. 5ml) に溶解し、氷冷下OXONE (6. 2mg)、水 (0. 3  
 ml) を加え、50分間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加  
 え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウム  
 で乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展  
 開溶媒、酢酸エチル : n-ヘキサン = 4 : 1) で精製して目的物 14. 2mg (   
 10 収率 94%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270MHz, CDC13)  $\delta$  : 0. 65 (3H, s)、0. 75 (3H, s)、0. 82-2. 37 (24H, m)、2. 55-2. 90 (   
 6H, m)、3. 28 (3H, s)、3. 43 (1H, t, J=7. 8Hz)、  
 3. 24-3. 37 (1H, m)、3. 90 (4H, s)、4. 38-4. 51  
 15 (2H, m)、4. 53 (2H, s)、5. 68-5. 95 (2H, m)、6. 71 (2H, d, J=8. 6Hz)、7. 26 (2H, brs)。

Rf値 (シリカゲルプレート、展開溶媒 ; 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 2) :  
 0. 07。

(第8工程)



20

17 $\beta$ -ヒドロキシ-11 $\beta$ -[4-{5-(4, 4, 5, 5, 5-ペンタフル  
 オロペンチルスルフィニル) ペンチルオキシ} フェニル] - 5 $\alpha$ -アンドロス  
 タン-3-オン

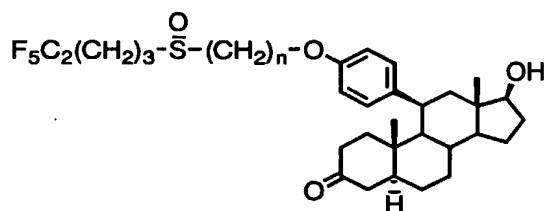
3, 3-エチレンジオキシ-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-11 $\beta$ -[4-{5-  
 25 - (4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)-2-ペンテ

ニルオキシ} フェニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン (14.2 mg) を酢酸エチル (1 ml) に溶解し、10%パラジウム/炭素 (10 mg) を加え、室温下、水素雰囲気下2時間攪拌した。反応液を濾過、減圧下にて溶媒を留去して得られた残さをアセトン (2 ml) に溶解し、1N-塩酸 (1 ml) を加え、1.5時間加熱還流した。放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル : n-ヘキサン = 4 : 1) で精製して目的物 11.5 mg (収率 92%) を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  (270 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  : 0.75 (3H, s), 0.86 (3H, s), 0.82-2.37 (31H, m), 2.62-2.87 (4H, m), 3.28-3.40 (1H, m), 3.48-3.58 (1H, m), 3.96 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 6.72 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.26 (2H, br s)。

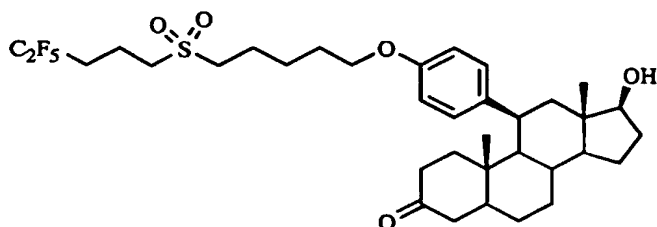
15 Mass (FAB) : 661 ( $M+1$ )

実施例 151 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	分子量	Mass (ESI)
152	7	688	689

20 [実施例 153]



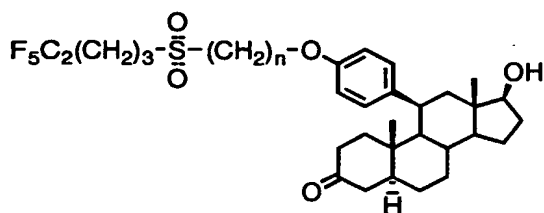
17β-ヒドロキシ-11β-[4-{5-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルホニル)ペンチルオキシ}フェニル]-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

実施例151で得られた17β-ヒドロキシ-11β-[4-{7-(4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチルスルフィニル)ペンチルオキシ}フェニル]-5α-アンドロスタン-3-オン(3.0mg)をテトラヒドロフラン(1.0ml)に溶解し、室温下OXONE(2.8mg)及び水(0.5ml)を加え、1.5時間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=2:1)で精製して目的物2.6mg(収率85%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(270MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.75(3H, s)、0.86(3H, s)、0.78-2.39(31H, m)、2.98-3.09(4H, m)、3.29-3.38(1H, m)、3.48-3.59(1H, m)、3.96(2H, t, J=5.9Hz)、6.72(2H, d, J=8.4Hz)、7.26(2H, brs)。

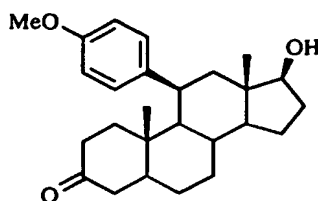
Mass(EI): 676(M<sup>+</sup>)

実施例153と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	分子量	Mass(FAB)
154	7	704	705

[実施例155]



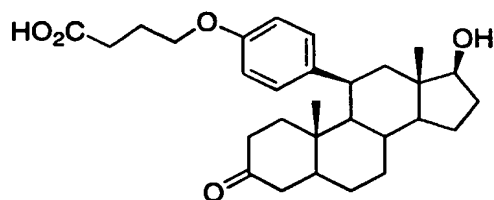
17β-ヒドロキシ-11β-(4-メトキシフェニル)-5α-アンドロスタン-3-オンの合成

3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-(4-メトキシフェニル)-5α-アンドロスタン (5.8 mg) のアセトン (2 ml) 溶液に 1 N-塩酸 (1 ml) を加え、1 時間加熱還流した。放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過後、減圧下溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 1) で精製して目的物 4.6 mg (収率 97%) を得た。

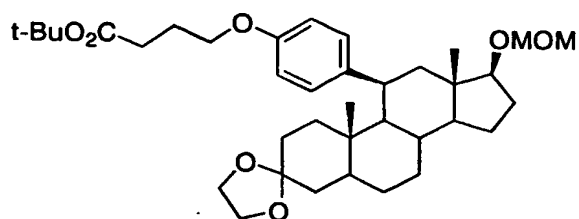
<sup>1</sup>H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ : 0.75 (3H, s), 0.86 (3H, s), 0.82-2.30 (21H, m), 3.31-3.39 (1H, m), 3.48-3.59 (1H, m), 3.79 (3H, s), 6.74 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.28 (2H, br s)。

Mass (EI) : 396 (M<sup>+</sup>)

[実施例 156]



17β-ヒドロキシ-11β-[4-(3-カルボキシプロピルオキシ)フェニル]-5α-アンドロスタン-3-オンの合成  
(第 1 工程)



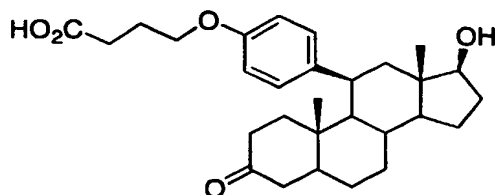
3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-[4-(3-tert-ブトキシカルボニルプロピルオキシ)フェニル]-5α-アンドロスタン

- 窒素雰囲気下、3, 3-エチレンジオキシ-17β-メトキシメトキシ-11β-(4-ヒドロキシフェニル)-5α-アンドロスタン (30.2 mg)、炭酸カリウム (89 mg)、3-プロモブタン酸 tert-ブチルエステル (0.029 ml)、よう化カリウム (21.3 mg) 及び 18-クラウン-6 (200 mg) を N, N-ジメチルアセトアミド (0.5 ml) に溶解し、60℃ にて 10 分間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチル、ヘキサン混合溶媒にて抽出した。
- 10、有機層を硫酸ナトリウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル: n-ヘキサン = 1: 5) で精製して目的物 38.1 mg (収率 97%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (270 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 7.40-7.20 (2H, m)、6.70 (2H, d, J = 8.4 Hz)、4.54 (2H, s)、3.96 (2H, t, J = 6.1 Hz)、3.91 (4H, s)、3.46 (1H, dd, J = 7.9, 8.1 Hz)、3.38-3.27 (1H, m)、3.28 (3H, s)、2.42 (2H, t, J = 7.3 Hz)、2.20-0.82 (2H, m)、1.45 (9H, s)、0.76 (3H, s)、0.65 (3H, s)。

20 Mass (EI): 612 (M<sup>+</sup>)

(第2工程)



17β-ヒドロキシ-11β-[4-(3-カルボキシプロピルオキシ)フェニル]-5α-アンドロスタン



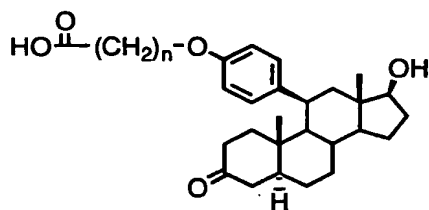
ニル] - 5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン

3, 3-エチレンジオキシー-17 $\beta$ -メトキシメトキシ-11 $\beta$ -[4-(3-  
-t-ブトキシカルボニルプロピルオキシ)フェニル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン  
(38.1mg) をアセトン(1ml) に溶解し、6N-塩酸(0.5ml) を  
5 加え、20分間加熱還流した。反応液にジクロロメタンを加え、硫酸ナトリウム  
にて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラ  
フィー(展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:1) で精製して目的物29  
.0mg (収率100%) を得た。

1H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 7.40-7.10 (2H,  
10 m)、6.72 (2H, d, J=8.8Hz)、3.84 (1H, brs)、3  
.99 (2H, t, J=6.0Hz)、3.54 (1H, dd, J=7.1, 8  
.5Hz)、3.33 (1H, dd, J=5.8, 6.0Hz)、2.57 (2  
H, t, J=7.1Hz)、2.28-1.86 (11H, m)、1.74-1  
.16 (9H, m)、1.08-0.90 (2H, m)、0.85 (3H, s)  
15 、0.74 (3H, s)。

Mass (ESI): 469 (M+1)

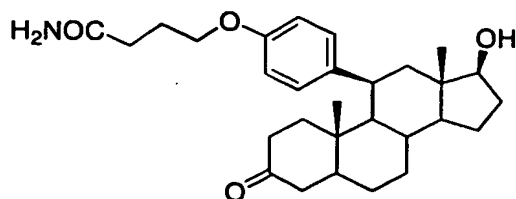
実施例156と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	分子量	Mass (ESI)
157	7	524	525

20

[実施例158]



17β-ヒドロキシ-11β-[4-(3-アミノカルボニルプロピルオキシ)フェニル]-5α-アンドロスタン-3-オン

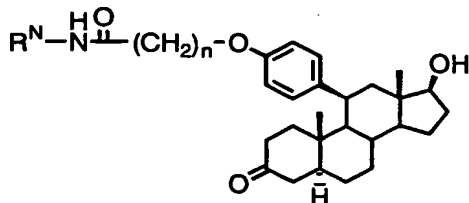
実施例 156 で得られた 17β-ヒドロキシ-11β-[4-(3-カルボキシプロピルオキシ)フェニル]-5α-アンドロスタン-3-オン (3.6 mg) をジクロロメタン (0.2 ml) に溶解し、-10℃にてトリエチルアミン (5.4 μl) 及びクロロ炭酸エチル (2.2 μl) を加え、5 分間攪拌した。反応液中にアンモニアガスを 5 分間吹き込み、-10℃にて 15 分間攪拌した。反応液に飽和塩化ナトリウム水溶液を加えジクロロメタンにて抽出し、硫酸ナトリウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル) で精製して目的物 3.6 mg (収率 100%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 7.40-7.18 (2H, m)、6.73 (2H, d, J=9.1 Hz)、5.48 (2H, br)、4.01 (2H, t, J=6.0 Hz)、3.54 (1H, dd, J=7.1, 8.5 Hz)、3.34 (1H, dd, J=6.0, 6.6 Hz)、2.29-1.87 (10H, m)、1.78-1.18 (10H, m)、1.08-0.90 (2H, m)、0.85 (3H, s)、0.74 (3H, s)。

Mass (ESI): 468 (M+1)

20

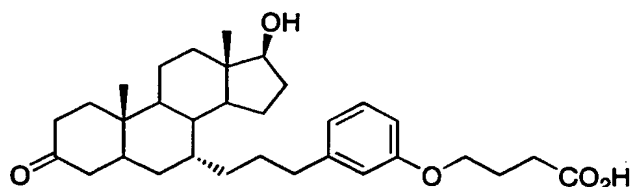
実施例 158 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	R <sup>N</sup>	分子量	Mass
-----	---	----------------	-----	------

159	3	n-pentyl	537	537 (EI)
160	7	H	523	524 (ESI)
161	7	n-pentyl	593	593 (EI)

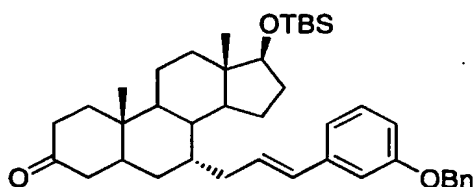
## [実施例162]



17β-ヒドロキシ-7α-[3-(3-カルボキシプロピルオキシフェニル

5 ) プロピル] - 5α-アンドロスタン-3-オン

(第1工程)



17β-(t-ブチルジメチルシリルオキシ)-7α-[3-(3-ベンジル  
オキシ)フェニル-2-プロペニル]-5α-アンドロスタン-3-オン

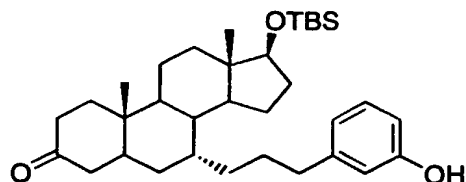
- 10 実施例3の第1工程で得られた17β-(t-ブチルジメチルシリルオキシ)-7α-(2-プロペン-1-イル)アンドロスタン-3-オン(110mg)をジクロロメタン(0.5ml)に溶解し、3-ベンジルオキシスチレン(156mg)及びベンジリデンビス(トリシクロヘキシルホスフィン)-ジクロロルテニウム(10.0mg)を加え、アルゴン雰囲気下、24時間加熱還流した。
- 15 放冷後、減圧下濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3)で精製して目的物104.1mg(収率67%)を得た。

1H-NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 7.49-7.28(5H, m)、7.21(1H, dd, J=7.9, 8.0Hz)、6.98-6.90(2H, m)、6.82(1H, dd, J=1.4, 8.0Hz)、6.30(1H, d, J=5.7Hz)、6.14-6.00(1H, m)、5.07(2

H, s), 3.57 (1H, dd,  $J=8.0, 8.5$  Hz), 2.46–0.92 (22H, m), 1.05 (3H, s), 0.88 (9H, s), 0.74 (3H, s), 0.01 (6H, s)。

Mass (EI) : 626 (M+)

5 (第2工程)



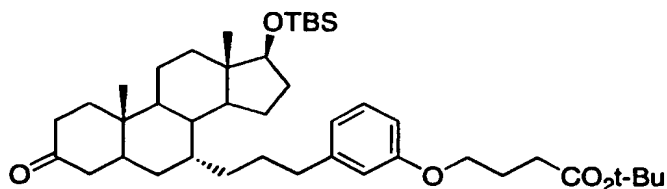
17β-(tert-butyldimethylsilyloxy)-7α-[3-(3-hydroxyphenyl)propyl]-5α-androstan-3-one

10 17β-(tert-butyldimethylsilyloxy)-7α-[3-(3-benzyloxyphenyl)propyl]-5α-androstan-3-one (104, 1mg) を酢酸エチル (20ml) に溶解し、酢酸 (0.2ml)、10%-パラジウム/炭素 (20mg) を加え、水素雰囲気下、25℃にて4時間攪拌した。反応液を濾過し、減圧下溶媒を留去し、目的物79.8mg (収率89%) を得た。

15 1H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 7.18–7.09 (1H, m), 6.73 (1H, d,  $J=7.7$  Hz), 6.69–6.62 (2H, m), 5.07 (1H, s), 3.54 (1H, dd,  $J=8.0, 8.8$  Hz), 2.66–2.20 (5H, m), 2.07–0.85 (21H, m), 1.02 (3H, s), 0.88 (9H, s), 0.70 (3H, s), 0.010  
20 (3H, s), 0.008 (3H, s)。

Mass (EI) : 538 (M+)

(第3工程)



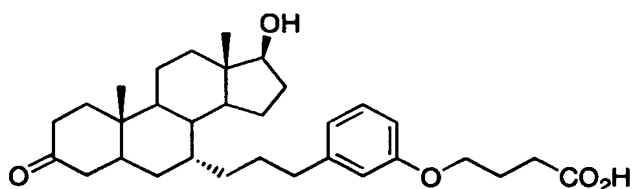
17β-(t-ブチルジメチルシリルオキシ)-7α-[3-{3-(3-t-ブトキシカルボニルプロポキシ)フェニル}プロピル]-5α-アンドロスタン-3-オン

窒素雰囲気下、17β-(t-ブチルジメチルシリルオキシ)-7α-[3-(3-ヒドロキシフェニル)プロピル]-5α-アンドロスタン-3-オン (30.2mg)、炭酸カリウム (62mg)、3-ブromobutan酸 t-ブチルエステル (0.020ml) 及び 18-クラウン-6 (100mg) を N,N-ジメチルアセトアミド (0.2ml) に溶解し、60℃にて10分間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチル、ヘキサン混合溶媒にて抽出した。有機層を硫酸ナトリウムにて乾燥し、濾過後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:5) で精製して目的物 24.8mg (収率80%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 7.22-7.13 (1H, m)、6.79-6.67 (3H, m)、3.98 (2H, t, J=6.1Hz)、3.54 (1H, dd, J=8.0, 8.5Hz)、2.65-2.14 (5H, m)、2.43 (2H, t, J=7.4Hz)、2.12-0.90 (23H, m)、1.45 (9H, s)、1.02 (3H, s)、0.88 (9H, s)、0.71 (3H, s)、0.009 (3H, s)、0.005 (3H, s)。

Mass (EI): 567 (M<sup>+</sup>)

(第4工程)



17β-ヒドロキシ-7α-[3-{3-(3-カルボキシプロポキシ)フェニル}プロピル]-5α-アンドロスタン-3-オン

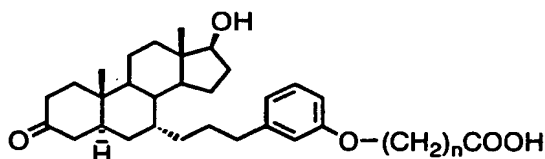
17β-(t-ブチルジメチルシリルオキシ)-7α-[3-{3-(3-t-ブトキシカルボニルプロポキシ)フェニル}プロピル]-5α-アンドロスタ

ン-3-オン (24.8 mg) をアセトン (4 ml) に溶解し、6 N-塩酸 (1 ml) を加え、2 時間加熱還流した。減圧下にて溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル : n-ヘキサン = 2 : 1) で精製して目的物 19.0 mg (収率 100%) を得た。

- 5  $^1\text{H-NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  : 7.16 (1H, dd,  $J = 7.1, 8.0$ ), 6.80–6.68 (3H, m), 4.02 (2H, dt,  $J = 1.4, 6.3$  Hz), 3.63 (1H, dd,  $J = 8.2, 8.8$  Hz), 3.56 (1H, br), 3.13–2.98 (4H, m), 2.45–1.95 (8H, m), 1.82–0.94 (18H, m), 1.03 (3H, s), 0.74 (3H, s)。
- 10

Mass (ESI) : 511 ( $M+1$ )

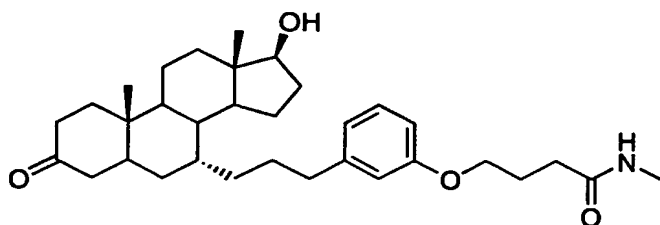
実施例 162 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	分子量	Mass (FAB)
163	4	524	525

15

[実施例 164]



17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -[3-[3-{3-(N-メチルアミノカルボニル)プロポキシ}フェニル]プロピル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オンの合成

20 成

実施例 162 で得られた 17 $\beta$ -ヒドロキシ-7 $\alpha$ -[3-{3-(3-カルボキシプロポキシ)フェニル}プロピル]-5 $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン (

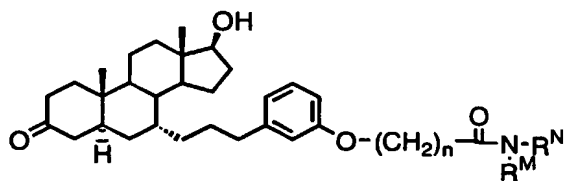
6. 6 mg) をテトラヒドロフラン (0. 5 ml) に溶解し、1- (N, N-ジメチルアミノプロピル) - 3-エチルカルボジイミド塩酸塩 (8. 1 mg)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール-水合物 (6. 4 mg) 及びメチルアミン 40%メタノール溶液 (60  $\mu$ l) を加え、25℃にて18時間攪拌した。酢酸エチル (2. 0 ml) を加え、1N-塩酸、1N-水酸化ナトリウム水溶液及び飽和食塩水にて洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムにて乾燥し、濾過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒、酢酸エチル : n-ヘキサン = 5 : 1) で精製して目的物 0. 6 mg (収率 8. 8%) を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  (270 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  : 0. 75 (3H, s)、1. 03 (3H, s)、1. 05-1. 95 (22H, m)、1. 95-2. 21 (5H, m)、2. 26-2. 42 (4H, m)、2. 51-2. 65 (2H, m)、2. 81 (3H, d)、3. 63 (1H, t,  $J=8. 1\text{ Hz}$ )、3. 99 (2H, t,  $J=5. 9\text{ Hz}$ )、6. 70 (3H, m)、7. 17 (1H, dd)。

15  $\text{Mass (ESI)}$  : 524 ( $M+1$ )。

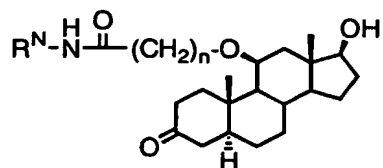
$R_f$  値 (シリカゲルプレート、展開溶媒 ; 酢酸エチル : n-ヘキサン = 4 : 1) : 0. 21。

実施例 164 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	$R^M$	$R^N$	分子量	$\text{Mass (ESI)}$
165	4	H	Me	537	538
166	4	Me	Me	551	552
167	4	- $(\text{CH}_2)_4$ -		577	578
168	3	Me	Me	537	538
169	3	- $(\text{CH}_2)_4$ -		563	564

実施例 1 1 4 と同様な方法により、以下の化合物を合成した。



実施例	n	R <sup>N</sup>	分子量	Mass (FAB)
170	5	H	419	420
171	5	n-pentyl	489	490
172	7	H	447	548
173	7	n-pentyl	517	518
174	9	H	475	476
175	9	n-pentyl	545	546
176	11	H	503	504
177	11	n-pentyl	573	574
178	13	H	531	532
179	13	n-pentyl	601	602

#### 5 【実施例 180】 アゴニスト作用及びアンタゴニスト作用の検討

実施例 4 の化合物のアンドロゲン受容体を介した転写活性に対するアゴニスト作用及びアンタゴニスト作用を検討した。

アゴニスト作用は、実施例 1 に記載の方法と同様の方法により測定し、以下の式によりアゴニスト活性を算出し、求めたアゴニスト活性から F I 5 値（化合物非添加時の転写活性の 5 倍の転写活性を示す化合物添加群の濃度）を算出した。ただし、化合物の添加濃度は 1, 10, 100, 1000, 10000 nmol/L とした。

アゴニスト活性 = 化合物添加時の転写活性 / 化合物非添加時の転写活性

アンタゴニスト作用は、実施例 2 に記載の方法と同様の方法により測定し、以下の式によりアンタゴニスト活性を算出し、求めたアンタゴニスト活性から I C 50 値（化合物非添加時の DHT 0.1 nmol/L の転写活性値を 50% に減少させる化合物添加群の濃度）を算出した。ただし、化合物の添加濃度は 1, 10, 100, 1000, 10000 nmol/L とし、それぞれの濃度において



DHT (0.1 nmol/L) 存在下で測定した。

アンタゴニスト活性＝化合物添加時の転写活性／化合物非添加時の転写活性×100

化合物	IC50値 (nM)	FI5値 (nM)
実施例9の化合物	451	ND*
10	937	ND
14	1984	ND
18	342	ND
19	295	ND
20	37	ND
23	1302	ND
24	477	ND
25	415	ND
26	1128	ND
27	421	ND
28	1614	ND
29	304	ND
30	733	ND
42	342	ND
43	1299	ND
46	1751	ND
50	737	ND
51	474	ND
52	277	ND
64	809	ND
65	1831	ND
73	1099	ND
74	2036	ND
96	1601	ND
164	291	ND
167	475	ND
168	540	ND
EM-101	2619	ND
ヒドロキシフルタミド	31	1000
ビカルタミド	136	767

5 \*表中、ND\*は、化合物添加群の濃度が10000 nMであっても化合物添加

群の転写活性が化合物非添加群の転写活性の5倍未満であり、FI5値の算定が不可能であることを示す。

上記試験結果により、既存の抗アンドロゲン剤であるヒドロキシフルタミド及びピカルタミドはアンドロゲン受容体を介した転写活性に対してアゴニスト作用も示し、本発明の化合物はアンドロゲン受容体を介した転写活性に対して実質的にアゴニスト作用を示さないことが確認された。これにより、本発明の化合物は、従来使用されている抗アンドロゲン剤が持つアンドロゲン抵抗性の発現が低減されることが示唆された。

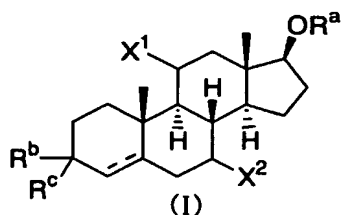
また、本発明の化合物は、EM-101と比較してアゴニスト作用が優れていることが確認された。これにより、本発明の化合物は、医薬として使用するのに十分な抗アンドロゲン作用を有し、抗アンドロゲン剤として好適に使用されることが示唆された。

#### 産業上の利用の可能性

本発明の一般式(I)で表される化合物、及び本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質は、長期投与によるアンドロゲン抵抗性の発現、及び／又は肝毒性などの副作用を示さない抗アンドロゲン剤となることが期待され、医薬組成物、例えば、前立腺癌、前立腺肥大症、男性型脱毛症、性的早熟、尋常性座瘡、脂漏症、及び多毛症等の疾患の治療剤として有用となることが期待される。また、本発明の一般式(I)で表される化合物、及び本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質を、予め投与しておけば、前立腺癌、前立腺肥大症、男性型脱毛症、性的早熟、尋常性座瘡、脂漏症、及び多毛症等の疾患の発症を防ぐか遅延させることが期待できるので、これらの疾患の予防剤となることも期待できる。さらに、本発明の一般式(I)で表される化合物、及び本発明のアンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニストとして作用しない物質は、細胞毒性などの毒性が低減されているので、上記の疾患の治療剤及び／又は予防剤として好適に使用できることが期待される。

## 請 求 の 範 囲

## 1. 一般式 (I)



5

[式中、 $X^1$ 及び $X^2$ は、独立して水素原子、又は一般式 (I I)



で表される基を示し、 $R^a$ は、水素原子又は水酸基の保護基を示し、 $R^b$ 及び $R^c$ は、それらが結合している3位の炭素原子と一緒に、保護されていてもよい  $-(C=O)-$  を示し、破線は、実線と共に、単結合又は二重結合を形成していることを示す。

更に、 $Ar$ は、単結合又は芳香族炭化水素基を示し、 $A$ は、メチレン基又は  $-O-$  を示し、 $R^1$ は、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、又は置換されていてもよいアルキニル基を示す。

ただし、 $X^1$ 及び $X^2$ は、同時に水素原子であることはない。]

で表される化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

2.  $R^1$ が、 $R^{1a}$ 

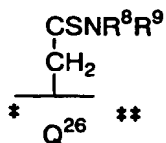
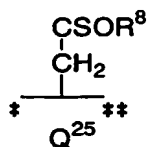
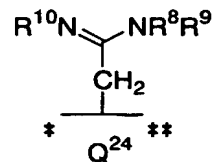
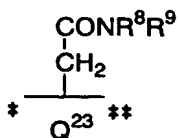
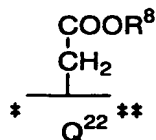
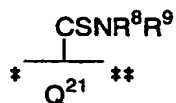
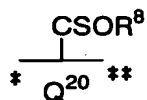
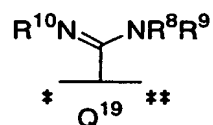
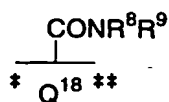
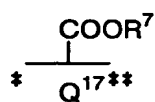
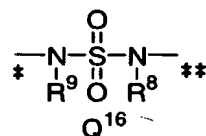
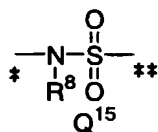
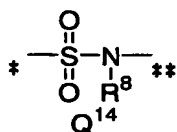
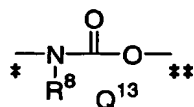
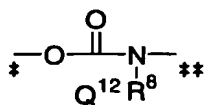
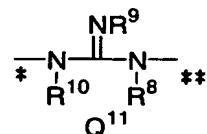
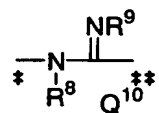
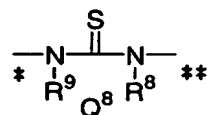
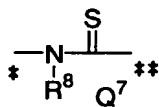
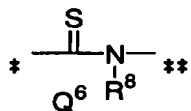
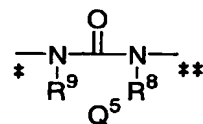
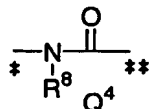
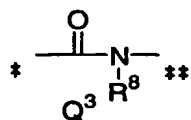
[ここで、 $R^{1a}$ は、一般式 (I I I)

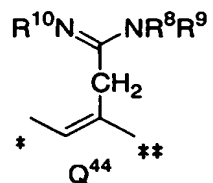
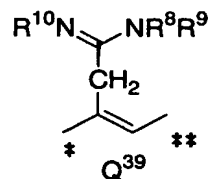
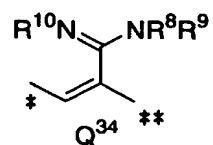
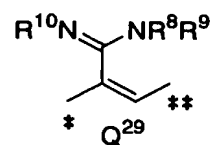
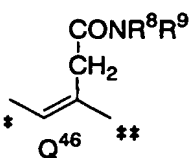
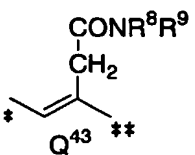
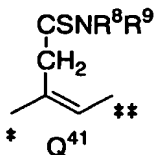
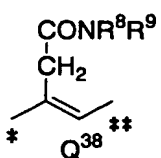
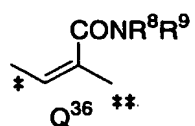
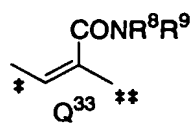
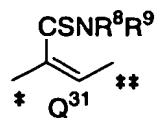
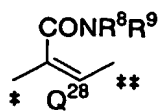
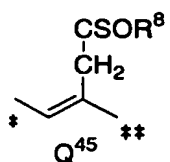
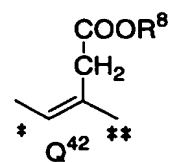
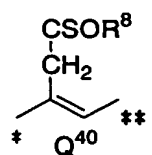
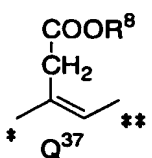
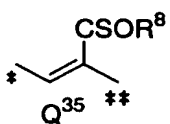
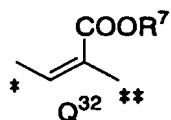
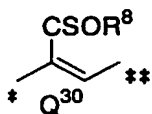
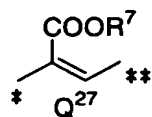


{式中、 $G$ は、置換されていてもよい炭素数1~30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキレン基、置換されていてもよい炭素数2~30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基、又は置換されていてもよい炭素数2~30の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基を示し、 $E$ は、単結合又は  $-O-$  を示し、 $J$ は、単結合、置換されていてもよい芳香族炭化水素基、又は置換されていてもよい複素環基を示し、 $Y$ は、単結合又は  $-O-$  を示し、 $L$ は、単結合、炭素数1~10の直鎖も

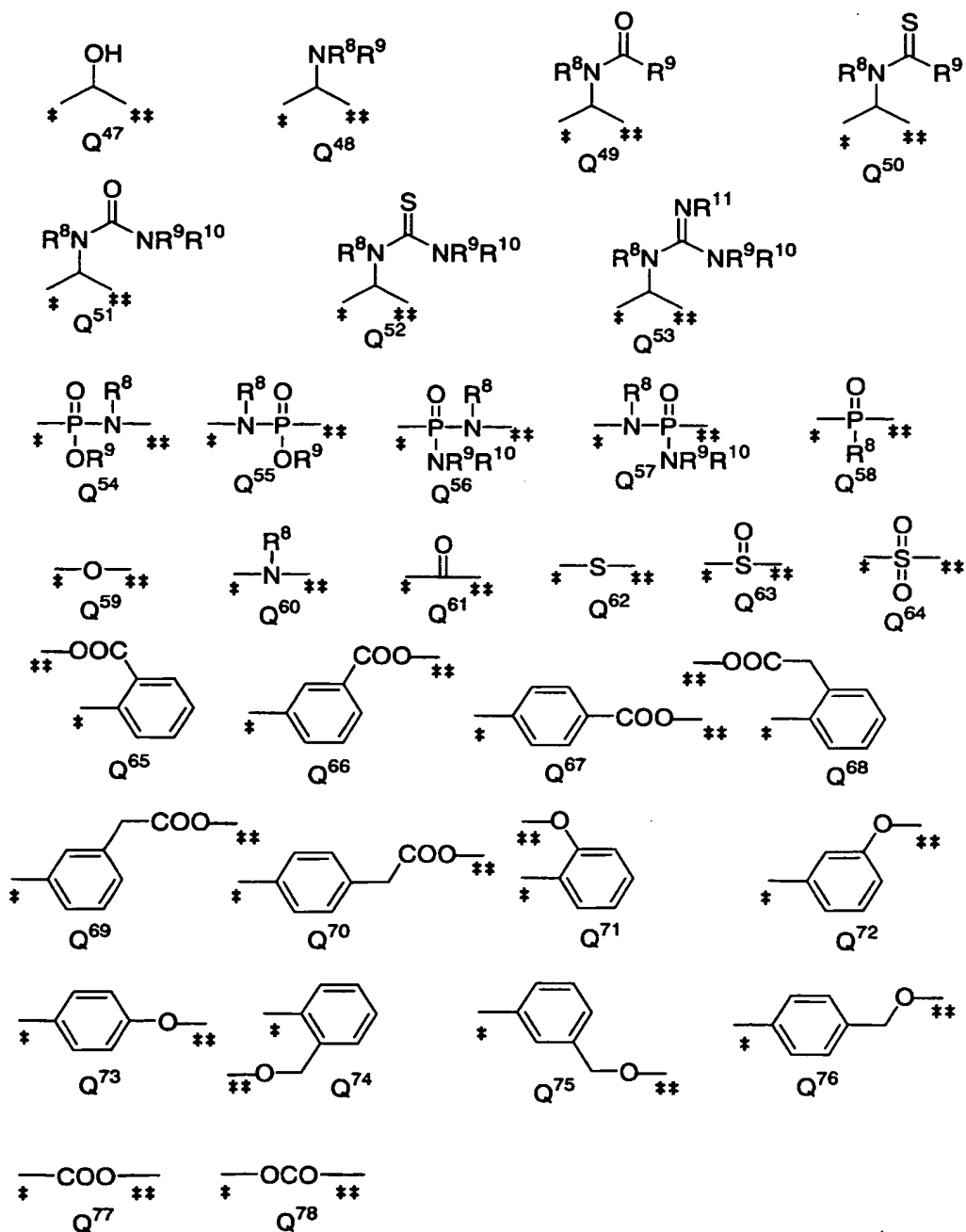
25

しくは分岐鎖状のアルキレン基、炭素数2～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニレン基、又は炭素数2～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニレン基を示し、Qは、単結合、又は下記式：





、及び



(ここで、 $\text{R}^7$ 及び $\text{R}^8$ は、独立して、水素原子、又は炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示し、 $\text{R}^9$ 、 $\text{R}^{10}$ 、及び $\text{R}^{11}$ は、それぞれ独立して、水素原子、又は炭素数1～3の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示す。)

から選択される1つの基を示し、Zは、水素原子、ハロゲン原子で置換されてい

てもよい炭素数 1 ～ 10 の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数 2 ～ 10 の直鎖もしくは分岐鎖状のアルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数 2 ～ 10 の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキニル基、 $-O-R^d$ （ここで、 $R^d$ は、水素原子、又は水酸基の保護基を示す）、又は $-COOH$ を示す。）を示す。ただし、 $Q$ が $Q^3$ である場合、 $Q^3$ の窒素原子と $R^8$ と $Z$ とが一緒になって複素環基を形成してもよい。} ]

で表される、請求項 1 記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

3.  $Q$ が、 $Q^2$  [ここで、 $Q^2$ は、単結合、 $Q^{62}$ 、 $Q^{63}$ 、 $Q^{64}$ 、 $Q^3$ （更にここで、 $R^8$ は、前記と同義である。）、 $Q^4$ （更にここで、 $R^8$ は、前記と同義である。）、 $Q^{17}$ （更にここで、 $R^7$ は、前記と同義である。）、 $Q^{32}$ （更にここで、 $R^7$ は、前記と同義である。）、又は $Q^{27}$ （更にここで、 $R^7$ は、前記と同義である。）を示す。] である、請求項 1 又は 2 記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

4.  $X^1$ が $-Ar-A-R^1$ （式中、 $Ar$ 、 $A$ 及び $R^1$ は前記と同義である）であり、かつ、 $X^2$ が水素原子である、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

5.  $X^1$ が水素原子であり、かつ、 $X^2$ が $-Ar-A-R^1$ （式中、 $Ar$ 、 $A$ 及び $R^1$ は前記と同義である）である、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

6. 破線が、実線と共に、単結合を形成している、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

7. 11 位の $X^1$ の立体配置が、 $\beta$ 配置である、請求項 1 又は 2 又は 3 又は 4 又は 6 記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

8. 7 位の $X^2$ の立体配置が、 $\alpha$ 配置である、請求項 1 又は 2 又は 3 又は 5 又は 6 記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

9.  $Z$ が、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数 1 ～ 10 の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基である、請求項 1 ～ 8 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

10. Zが、4, 4, 5, 5, 5-ペンタフルオロペンチル基である、請求項9記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

11. Jが、単結合である、請求項1～10のいずれか1項記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

5 12. Arが、単結合である、請求項1～11のいずれか1項記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

13. Aが、メチレン基である、請求項1～12のいずれか1項記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

10 14. Qが、 $Q^{62}$ 、 $Q^{63}$ 、又は $Q^{64}$ である、請求項1～13のいずれか1項記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

15 15. Qが、 $R^8$ が水素原子である $Q^3$ 、又は $R^8$ が水素原子である $Q^4$ である、請求項1～13のいずれか1項記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

16. Qが、 $R^7$ が水素原子である $Q^{17}$ 、 $R^7$ が水素原子である $Q^{32}$ 、又は $R^7$ が水素原子である $Q^{27}$ である、請求項1～13のいずれか1項記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

17. Arが、芳香族炭化水素基であり、かつAが、 $-O-$ である、請求項1～11のいずれか1項記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

20 18. Gが、置換されていてもよい炭素数2～15の直鎖状のアルキレン基である、請求項1～17のいずれか1項記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

25 19. Gが、置換されていてもよい炭素数2～13の直鎖状のアルキレン基である、請求項18記載の化合物又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

20. 破線が実線と共に単結合を示し、 $X^2$ が、 $-(CH_2)_p-CO-NR^8$   
 $Z^1$  ( $p$ は1以上の整数を示し、 $R^8$ は水素原子、又は炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示し、 $Z^1$ は水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されていてもよい炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を示す



。)、 $-(CH_2)_p-SO_2-Z^1$  ( $p$ 、 $Z^1$ は前記と同じ意味を示す。)、 $-(CH_2)_p-SO-Z^1$  ( $p$ 、 $Z^1$ は前記と同じ意味を示す。)、 $-Ph-O-(CH_2)_p-CO-NR^8Z^1$  ( $Ph$ はフェニレン基を示し、 $p$ 、 $R^8$ 、 $Z^1$ は前記と同じ意味を示す。)、 $-Ph-O-(CH_2)_p-H$  ( $p$ は前記と同じ意味を示す。) からなる群より選ばれるいずれか1つの基である請求項1記載の化合物もしくは物質又はそれらの薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

21.  $X^2$ が、 $-(CH_2)_p-COOH$  ( $p$ は1以上の整数を示す。)、 $-(CH_2)_p-OH$  ( $p$ は前記と同じ意味を示す。)、 $-Ph-O-(CH_2)_p-COOH$  ( $Ph$ はフェニレン基を示し、 $p$ は前記と同じ意味を示す。)、 $-(CH_2)_p-CO-NR^8Z^2$  ( $p$ は前記と同じ意味を示し、 $R^8$ は水素原子、又は炭素数1~6の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示し、 $Z^2$ はシクロアルキル基、水酸基、カルボキシル基、複素環基、及びフェニル基からなる群より選ばれるいずれか1つの基で置換された炭素数1~10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を示すか、又は、 $-NR^8Z^2$ は、 $N$ と $R^8$ と $Z^2$ とが一緒になって複素環を形成してもよい。)、 $-(CH_2)_p-Ph-O-(CH_2)_q-CO-NR^8Z^3$  ( $Ph$ 、 $p$ 、 $R^8$ は前記と同じ意味を示し、 $q$ は1以上の整数を示し、 $Z^3$ は水素原子、又は、シクロアルキル基、水酸基、カルボキシル基、複素環基、及びフェニル基からなる群より選ばれるいずれか1つの基で置換されていてもよい炭素数1~10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を示すか、又は、 $-NR^8Z^3$ は、 $N$ と $R^8$ と $Z^3$ とが一緒になって複素環を形成してもよい。)、 $-(CH_2)_p-CH(COOH)-(CH_2)_3-CF_2-CF_3$  ( $p$ は前記と同じ意味を示す。) からなる群より選ばれるいずれか1つの基である請求項1記載の化合物もしくは物質又はそれらの薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

22.  $X^1$ が、 $-(CH_2)_p-COOH$  ( $p$ は1以上の整数を示す。)、 $-(CH_2)_p-CH(COOH)-(CH_2)_3-CF_2-CF_3$  ( $p$ は前記と同じ意味を示す。)、 $-(CH_2)_p-CH(COOMe)-(CH_2)_3-CF_2-CF_3$  ( $p$ は前記と同じ意味を示す。)、 $-O-(CH_2)_p-COOH$  ( $p$ は前記と同じ意味を示す。)、 $-O-(CH_2)_p-CH(COOH)-(CH_2)_3-CF_2-CF_3$  ( $p$ は前記と同じ意味を示す。)、 $-(CH_2)_p-S-(CH_2)_3$

- $-\text{CF}_2-\text{CF}_3$  (pは前記と同じ意味を示す。)、 $-(\text{CH}_2)_p-\text{SO}-(\text{CH}_2)_3-\text{CF}_2-\text{CF}_3$  (pは前記と同じ意味を示す。)、 $-\text{O}-(\text{CH}_2)_p-\text{SO}-(\text{CH}_2)_3-\text{CF}_2-\text{CF}_3$  (pは前記と同じ意味を示す。)、 $-\text{O}-(\text{CH}_2)_p-\text{SO}_2-(\text{CH}_2)_3-\text{CF}_2-\text{CF}_3$  (pは前記と同じ意味を示す。)  
 5、 $-\text{Ph}-\text{O}-\text{CH}_3$  (Phはフェニレン基を示す。)、 $-\text{Ph}-\text{O}-(\text{CH}_2)_p-\text{COOH}$  (Ph、pは前記と同じ意味を示す。)、 $-(\text{CH}_2)_p-\text{CO}-\text{NR}^8\text{Z}^3$  (pは前記と同じ意味を示し、 $\text{R}^8$ は水素原子、又は炭素数1～6の直鎖もしくは分岐鎖状の低級アルキル基を示し、 $\text{Z}^3$ は水素原子、又は、シクロアルキル基、水酸基、カルボキシル基、複素環基、及びフェニル基からなる群より  
 10 選ばれるいずれか1つの基で置換されていてもよい炭素数1～10の直鎖もしくは分岐鎖状のアルキル基を示すか、又は、 $-\text{NR}^8\text{Z}^3$ は、Nと $\text{R}^8$ と $\text{Z}^3$ とが一緒になって複素環を形成してもよい。)、 $-\text{Ph}-\text{O}-(\text{CH}_2)_p-\text{CO}-\text{NR}^8\text{Z}^3$  (Ph、p、 $\text{R}^8$ 、 $\text{Z}^3$ 、 $-\text{NR}^8\text{Z}^3$ は前記と同じ意味を示す。)、 $-\text{O}-(\text{CH}_2)_p-\text{CO}-\text{NR}^8\text{Z}^3$  (p、 $\text{R}^8$ 、 $\text{Z}^3$ 、 $-\text{NR}^8\text{Z}^3$ は前記と同じ意味を示す。)  
 15 からの群より選ばれるいずれか1つの基である請求項1記載の化合物もしくは物質又はそれらの薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

23.  $17\beta$ -ヒドロキシ- $7\alpha$ -{7-(N,N-ジメチルアミノカルボニル)ヘプチル}- $5\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

20  $17\beta$ -ヒドロキシ- $7\alpha$ -{7-(N-エチルアミノカルボニル)ヘプチル}- $5\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

$17\beta$ -ヒドロキシ- $7\alpha$ -[7-(N-イソプロピルアミノカルボニル)ヘプチル]- $5\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

$17\beta$ -ヒドロキシ- $7\alpha$ -[7-(N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル)ヘプチル]- $5\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

25  $17\beta$ -ヒドロキシ- $7\alpha$ -[7-(N,N-ジエチルアミノカルボニル)ヘプチル]- $5\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

$17\beta$ -ヒドロキシ- $7\alpha$ -[7-(ピペリジノカルボニル)ヘプチル]- $5\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

$17\beta$ -ヒドロキシ- $7\alpha$ -[7-{N-(2-フリルメチル)アミノカルボニル}

- ル} ヘブチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- {7- (N-メチルアミノカルボニル) ヘブチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N-メチル-N-エチルアミノカルボニル
- 5 ) ヘブチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル) ヘブチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N-メチル-N-イソプロピルアミノカルボニル) ヘブチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (N-メチル-N-ベンジルアミノカルボニル) ヘブチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (1-ピロリジニルカルボニル) ヘブチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- (モルホリノカルボニル) ヘブチル] - 5  $\alpha$ -
- 15 -アンドロスタン-3-オン ;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N, N-ジメチルアミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N, N-ジエチルアミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 20 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [9- (モルホリノカルボニル) ノニル] - 5  $\alpha$ -
- 25 アンドロスタン-3-オン ;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [10- (N, N-ジメチルアミノカルボニル) デシル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;
- 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ - [7- {N- (2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル} ヘブチル] - 5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン ;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-プロピルアミノカルボニル)ヘプチル]  
]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-(N-ベンジルアミノカルボニル)ヘプチル]  
]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

5 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[7-{N-(2-フェニルエチル)アミノカルボ  
ニル}ヘプチル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-11  $\beta$ -[9-(N,N-ジエチルアミノカルボニル)ノ  
ニル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

10 1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{3-(N-メチルアミノカルボニル)  
}プロポキシ}フェニル]プロピル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン;

1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{3-(N,N-ジメチルアミノカル  
ボニル)プロポキシ}フェニル]プロピル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン  
;

15 及び1 7  $\beta$ -ヒドロキシ-7  $\alpha$ -[3-[3-{4-(1-ピロリジニルカルボ  
ニル)プロポキシ}フェニル]プロピル]-5  $\alpha$ -アンドロスタン-3-オン

から選択される請求項1~3のいずれか1項記載の化合物又はその薬学上許容し  
うる塩あるいはそれらのプロドラッグ。

2 4. アンドロゲン受容体に対し、アンタゴニストとして作用し、かつアゴニ  
ストとして作用しない物質又はその薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロド  
20 ラッグ。

2 5. 請求項1~2 4のいずれか1項記載の化合物もしくは物質又はそれらの  
薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグを有効成分として含有する医  
薬組成物。

2 6. 請求項1~2 4のいずれか1項記載の化合物もしくは物質又はそれらの  
25 薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグを有効成分として含有する抗  
アンドロゲン剤。

2 7. 請求項1~2 4のいずれか1項記載の化合物もしくは物質又はそれらの  
薬学上許容しうる塩あるいはそれらのプロドラッグを有効成分として含有する、  
前立腺癌、前立腺肥大症、男性型脱毛症、性的早熟、尋常性座瘡、脂漏症及び多

毛症から選択される疾患の予防もしくは治療剤。

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
PCT/JP00/05636

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl<sup>7</sup> C07J1/00, 31/00, 41/00, A61K31/568

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>7</sup> C07J1/00, 31/00, 41/00, A61K31/568

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
CA (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO, 9100732, A (ENDORECHERCHE INC.), 24 January, 1991 (24.01.91) & EP, 485392, A	1-27
A	US, 5227375, A (Endorecherche, Inc.), 13 July, 1993 (13.07.93) & WO, 9112206, A	1-27
A	US, 3413287, A (G.D.Searle & Co.), 26 November, 1968 (26.11.68) (Family: none)	1-27

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
12 September, 2000 (12.09.00)

Date of mailing of the international search report  
26 September, 2000 (26.09.00)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**



## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> C07J1/00, 31/00, 41/00, A61K31/568

## B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> C07J1/00, 31/00, 41/00, A61K31/568

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	WO, 9100732, A (ENDORECHERCHE INC.) 24.1月.1991 (24.01.91) & EP, 485392, A	1-27
A	US, 5227375, A (Endorecherche, Inc.) 13.7月.1993 (13.07.93) & WO, 9112206, A	1-27
A	US, 3413287, A (G.D.Searle & Co.) 26.11月.1968 (26.11.68)、(ファミリーなし)	1-27

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&amp;」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

12.09.00

国際調査報告の発送日

26.09.00

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

弘 實 謙二

4P

7433

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**